

(19)日本国特許庁 (JP)

(12) 公開特許公報 (A)

(11)特許出願公開番号

特開平8-27120

(43)公開日 平成8年(1996)1月30日

(51)Int.Cl^{*}

C 07 D 239/22

A 01 N 43/54

43/56

識別記号

庁内整理番号

F I

技術表示箇所

C

A 01 N 43/ 82

1 0 3

1 0 4

審査請求 未請求 請求項の数4 OL (全36頁) 最終頁に続く

(21)出願番号

特願平6-157053

(22)出願日

平成6年(1994)7月8日

(71)出願人 000003986

日産化学工業株式会社

東京都千代田区神田錦町3丁目7番地1

(72)発明者 三田 猛志

千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学
工業株式会社中央研究所内

(72)発明者 沼田 昭

千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学
工業株式会社中央研究所内

(72)発明者 石井 茂

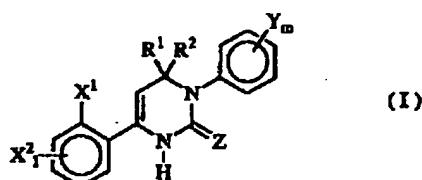
千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学
工業株式会社中央研究所内

最終頁に続く

(54)【発明の名称】 テトラヒドロピリミジノン誘導体

(57)【要約】 (修正有)

【構成】 下記式(I)



〔式中、R¹ 及び R² は水素原子、C₁ ~ 6 アルキル基、C₃ ~ 6 シクロアルキル基など、X¹ 及び X² はハロゲン原子、C₁ ~ 4 アルキル基、C₁ ~ 4 アルコキシ基など、Yはハロゲン原子、C₁ ~ 6 アルキル基、C₂ ~ 6 アルケニル基など、Zは酸素原子、イオウ原子又はイミノ基、mは1~5の整数を示す〕で表されるテトラヒドロピリミジノン誘導体及びそれを含有する有害生物防除剤。

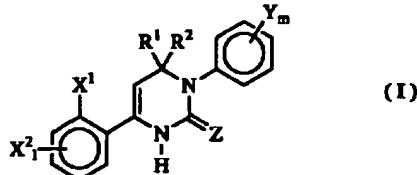
【効果】 この化合物は多くの農業害虫、ハダニ類に対して優れた殺虫・殺ダニ活性を有し、かつホ乳類、魚類及び益虫に対してはほとんど悪影響を及ぼさない、従つて有用な有害生物防除剤を提供することができる。

1

【特許請求の範囲】

【請求項1】 一般式(I)

【化1】



2

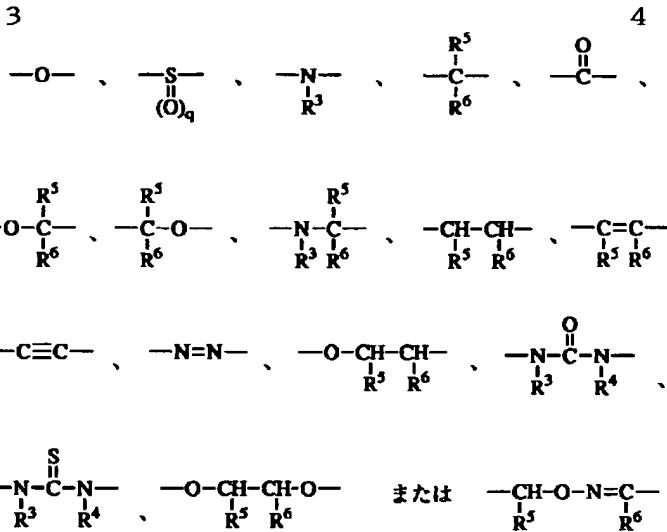
ニルオキシ基、C₃～C₆ハロシクロアルコキシ基、C₄～C₇ハロシクロアルキルアルコキシ基、C₁～C₆アルキルチオ基、C₂～C₆アルケニルチオ基、C₂～C₆アルキニル基、C₃～C₆シクロアルケニル基、C₁～C₆ハロアルキル基、C₂～C₆アルコキシアルキル基、C₃～C₆ハロシクロアルキル基、C₂～C₆ハロアルケニル基、C₂～C₆ハロアルキニル基、または無置換もしくは置換されていてもよいフェニル基（ただし、置換されていてもよい置換基としてはハロゲン原子、C₁～C₄アルキル基、C₁～C₄ハロアルキル基、C₁～C₄アルコキシ基、C₁～C₄ハロアルコキシ基、C₁～C₄アルキルチオ基またはC₁～C₄ハロアルキルチオ基を示し、置換基が2個以上の場合には置換基は同一であっても異なっていてもよい）を示し、

X¹、X²は各々独立して、ハロゲン原子、C₁～C₄アルキル基、C₁～C₄アルコキシ基、C₁～C₄アルキルチオ基、C₁～C₄ハロアルキル基、C₁～C₄ハロアルコキシ基、C₁～C₄ハロアルキルチオ基、アミノ基、シアノ基、またはニトロ基を示し、1は0～4の整数（ただし、2～4の場合、X²は同一であっても異なっていてもよい）を示し、Yはハロゲン原子、C₁～C₆アルキル基、C₂～C₆アルケニル基、C₂～C₆アルキニル基、C₃～C₆シクロアルキル基、C₁～C₆ハロアルキル基、C₂～C₆ハロアルケニル基、C₂～C₆ハロアルキニル基、C₃～C₆ハロシクロアルキル基、C₂～C₆シアノアルキル基、C₁～C₆ヒドロキシアルキル基、C₂～C₆カルボキシアルキル基、C₁～C₆アルコキシ基、C₂～C₆アルケニルオキシ基、C₂～C₆アルキニルオキシ基、C₃～C₆シクロアルキルオキシ基、C₁～C₆ハロアルコキシ基、C₂～C₆ハロアルケニルオキシ基、C₂～C₆ハロアルキ

10 ニル基、C₃～C₆シクロアルキルスルホニル基、C₁～C₆ハロアルキルスルホニル基、C₂～C₆アルコキシアルキル基、C₂～C₆アルコキシアルコキシ基、C₂～C₆アルキルチオアルキル基、C₂～C₆ハロアルコキシアルコキシ基、C₂～C₆アルキルカルボニルアルキル基、C₂～C₆アルコキシカルボニルオキシ基、C₂～C₆アルキルカルボニルオキシ基、C₂～C₆アルケニルカルボニル基、C₃～C₆アルキニルカルボニル基、C₄～C₇シクロアルキルカルボニル基、C₂～C₆ハロアルキルカルボニル基、C₂～C₆アルコキシカルボニルアルコキシ基、ニトロ基、シアノ基、ヒドロキシ基、カルボキシル基、チオシアネート基、イソチオシアネート基、C₂～C₆チオシアネートアルキル基、C₁～C₆アルキルスルホニルオキシ基、C₂～C₆アルキルチオカルボニル基、アミノ基(-NR³R⁴)、アミノカルボニル基(-CONR³R⁴)、アミノカルボニルオキシ基(-OCO NR³R⁴)、アミド基(-NR³CO₂)、アルコキシカルボニルアミノ基(-NR³CO₂R⁴)、アミノスルホニル基(-SO₂NR³R⁴)、チオアミド基(-NR³CSR⁴)、メチレンジオキシ基、ハロメチレンジオキシ基、エチレンジオキシ基、ハロエチレンジオキシ基、トリメチルシリル基または

20 【化2】 $\text{—}(\text{W})_n\text{Ar}$ 基
 (ただし、Wは

30 【化3】



(ただし、R³およびR⁴は各々独立して水素原子、C₁～C₆アルキル基、C₂～C₆アルケニル基、C₂～C₆アルキニル基、C₁～C₆ハロアルキル基、C₂～C₆ハロアルケニル基、C₂～C₆ハロアルキニル基、C₂～C₆アルコキシカルボニル基、C₂～C₆アルコキシカルボニル基またはベンジル基を示し、R⁵およびR⁶は各々独立して水素原子、ハロゲン原子、C₁～C₆アルキル基、C₃～C₆シクロアルキル基、シアノ基またはフェニル基を示し、

qは0～2の整数を示す。)を示し、

n は0または1の整数を示し、

Arは無置換または置換されていてもよいフェニル基、ナフチル基、フリル基、チエニル基、ピロリル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアジアゾリル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピリダジル基、ピリミジル基、ピラジル基、キノリル基またはキノキザリル基（ただし、置換されていてもよい置換基としてはハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁～C₄アルキル基、C₁～C₄ハロアルキル基、C₁～C₄アルコキシ基、C₁～C₄ハロアルコキシ基、C₁～C₄アルキルチオ基、C₁～C₄ハロアルキルチオ基、C₁～C₄アルキルスルホニル基、C₁～C₄ハロアルキルスルホニル基、C₂～C₄アルコキシカルボニル基、カルボキシル基、アミノ基、モノC₁～C₄アルキルアミノ基、ジC₁～C₄アルキルアミノ基、フェニル基、ベンジル基、メチレンジオキシ基またはハロメチレンジオキシ基を示し、置換基が2個以上の場合には置換基は同一であっても異なっていてもよい）を示す。】を示し、

mは1～5の整数（ただし、2～5の場合はYは同一であっても異なっていてもよい）を示し、

Zは酸素原子、イオウ原子またはイミノ基を示す。]で表されるテトラヒドロピリミジノ誘導体。

【請求項2】 R¹、R²が各々独立して水素原子またはC₁～C₆アルキル基を示し、

X¹、X²がハロゲン原子、C₁～C₆ハロアルキル基またはC₁～C₆

*～C₆アルコキシ基を示し、

Yがハロゲン原子、C₁～C₆アルキル基、C₁～C₆アルコキシ基、C₁～C₆ハロアルキル基、C₁～C₆ハロアルコキシ基、ニトロ基または置換されていてもよいピリジルオキシ基（ただし、置換されていてもよい置換基としてはハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁～C₆ハロアルキル基またはC₁～C₆ハロアルコキシ基を示す）、

Zが酸素原子を示し、

1が0～2の整数を示し、
mが1～3の整数を示す請求項1記載のテトラヒドロピリミジン誘導体

【請求項3】 請求項1記載のテトラヒドロピリミジノン誘導体の1種または2種以上を有効成分として含有することを特徴とする有害生物防除剤

【請求項4】 請求項2記載のテトラヒドロピリミジノン誘導体の1種または2種以上を有効成分として含有することを特徴とする有害生物防除剤。

【発明の詳細】

【0001】
【産業上の利用分野】本発明は、新規なテトラヒドロピリミジノン誘導体誘導体ならびに該誘導体を有効成分として含有する有害生物防除剤に関する

[0002]

【従来の技術】従来、テトラヒドロピリミジノン誘導体に関する特許及び文献に記載がある。ヘテロサイクルス (Heterocycles) 14巻、285頁(1980)、ジャーナル・オブ・ケミカル・ソサイヤティ・パーキン・トランス1 (J. Chem. Soc., Perkin Trans. 1) 489頁及び1622頁(1981)、およびジャーナル・オブ・ヘテロサイクリック・ケミストリー (J. Heterocycl. Chem.) 18巻、1469頁(1981)には1位と4位にフェニル基を有する1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリミジン-2-オンが記載されている。

) が、上記文献には有害生物防除剤としての活性は何ら示

されていない。

【0003】又、ドイツ特許DE 2142385には中枢神経作用活性を有する4位にメタ位またはパラ位に置換されたフェニル基を有する1, 2, 3, 6-テトラヒドロビリミジン-2-オンが記載されているが、本発明の4位にオルト位に置換されたフェニル基を有する1, 2, 3, 6-テトラヒドロビリミジン-2-オンは記載されていない。さらに有害生物防除剤としての活性は明らか示されていない。

【0004】

【発明が解決しようとする課題】殺虫剤の長年にわたる使用により、近年、害虫が抵抗性を獲得し、従来の殺虫剤による防除が困難になっている。また殺虫剤の一部は毒性が高く、あるものは残留性により生態系を乱しつつある。よって低毒性かつ低残留性の新規な殺虫剤の開発が常に期待されている。

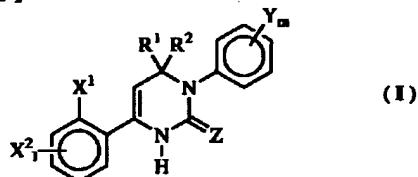
【0005】本発明者らはテトラヒドロビリミジン誘導体について鋭意研究を重ねた結果、新規な1, 4-ジフェニル-1, 2, 3, 6-テトラヒドロビリミジン-2-オン誘導体が低薬量で優れた殺虫活性を示し、かつホ乳動物、魚類および益虫に対してはほとんど悪影響がない極めて有用な化合物であることを見出し本発明を完成了。

【0006】

【課題を解決するための手段】本発明は一般式(I)

【0007】

【化4】

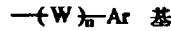


【0008】〔式中、R¹、R²は各々独立して、水素原子、C₁～C₆アルキル基、C₃～C₆シクロアルキル基、C₂～C₆アルケニル基、C₂～C₆アルキニル基、C₅～C₆シクロアルケニル基、C₁～C₆ハロアルキル基、C₂～C₆アルコキシアルキル基、C₃～C₆ハロシクロアルキル基、C₂～C₆ハロアルケニル基、C₂～C₆ハロアルキニル基、または無置換もしくは置換されていてもよいフェニル基（ただし、置換されていてもよい置換基としてはハロゲン原子、C₁～C₄アルキル基、C₁～C₄ハロアルキル基、C₁～C₄アルコキシ基、C₁～C₄ハロアルコキシ基、C₁～C₄アルキルチオ基またはC₁～C₄ハロアルキルチオ基を示し、置換基が2個以上の場合には置換基は同一であっても異なっていてもよい）を示し、X¹、X²は各々独立して、ハロゲン原子、C₁～C₄アルキル基、C₁～C₄アルコキシ基、C₁～C₄アルキルチオ基、C₁～C₄ハロアルキル基、C₁～C₄ハロアルコキシ基、C₁～C₄ハロアルキルチオ基、アミノ基、シアノ基、またはニトロ基を示し、1は0～4の整数（ただし、2

～4の場合、X²は同一であっても異なっていてもよい）を示し、Yはハロゲン原子、C₁～C₆アルキル基、C₂～C₆アルケニル基、C₂～C₆アルキニル基、C₃～C₆シクロアルキル基、C₁～C₆ハロアルキル基、C₂～C₆ハロアルケニル基、C₂～C₆ハロアルキニル基、C₃～C₆ハロシクロアルキル基、C₂～C₆シアノアルキル基、C₁～C₆ヒドロキシアルキル基、C₂～C₆カルボキシアルキル基、C₁～C₆アルコキシ基、C₂～C₆アルケニルオキシ基、C₂～C₆アルキニルオキシ基、C₃～C₆シクロアルキルオキシ基、C₁～C₆ハロアルコキシ基、C₂～C₆ハロアルキニルオキシ基、C₃～C₆ハロシクロアルコキシ基、C₁～C₆アルキルチオ基、C₂～C₆アルケニルチオ基、C₂～C₆アルキニルチオ基、C₃～C₆シクロアルキルチオ基、C₁～C₆ハロアルキルチオ基、C₂～C₆アルケニルスルフィニル基、C₂～C₆アルキニルスルフィニル基、C₃～C₆シクロアルキルスルフィニル基、C₁～C₆ハロアルキルスルフィニル基、C₁～C₆アルキルスルホニル基、C₂～C₆アルケニルスルホニル基、C₃～C₆シクロアルキルスルホニル基、C₁～C₆ハロアルキルスルホニル基、C₂～C₆アルコキシアルコキシ基、C₂～C₆ハロアルコキシアルコキシ基、C₂～C₆アルキルチオアルキル基、C₂～C₆アルキルチオアルコキシ基、C₃～C₆アルコキシカルボニルアルキル基、C₃～C₆アルキルカルボニルカルボニルアルキル基、C₂～C₆アルコキシカルボニルオキシ基、C₂～C₆アルキルカルボニルオキシ基、C₂～C₆アルキルカルボニル基、C₃～C₆アルキニルカルボニル基、C₃～C₆アルキニルカルボニル基、C₃～C₆シクロアルキルカルボニル基、C₂～C₆ハロアルキルカルボニル基、C₂～C₆アルコキシカルボニル基、C₃～C₆アルコキシカルボニルアルコキシ基、ニトロ基、シアノ基、ヒドロキシ基、カルボキシル基、チオシアネート基、イソチオシアネート基、C₂～C₆チオシアネートアルキル基、C₁～C₆アルキルスルホニルオキシ基、C₂～C₆アルキルチオカルボニル基、アミノ基(-NR³R⁴)、アミノカルボニル基(-CONR³R⁴)、アミノカルボニルオキシ基(-OCNR³R⁴)、アミド基(-NR³COR⁴)、アルコキシカルボニルアミノ基(-NR³CO₂R⁴)、アミノスルホニル基(-SO₂NR³R⁴)、チオアミド基(-NR³CSR⁴)、メチレンジオキシ基、ハロメチレンジオキシ基、エチレンジオキシ基、ハロエチレンジオキシ基、トリメチルシリル基または

【0009】

【化5】

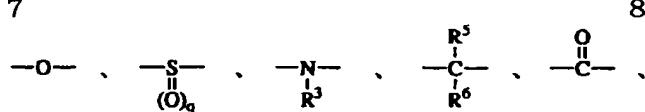


【0010】(ただし、Wは

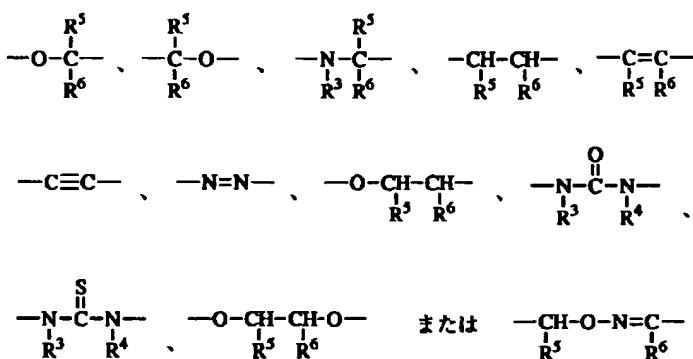
【0011】

【化6】

7



8



【0012】(ただし、R³およびR⁴は各々独立して水素原子、C₁～C₆アルキル基、C₂～C₆アルケニル基、C₂～C₆アルキニル基、C₁～C₆ハロアルキル基、C₂～C₆ハロアルケニル基、C₂～C₆ハロアルキニル基、C₂～C₆アルキルカルボニル基、C₂～C₆アルコキシカルボニル基、フェニル基またはベンジル基を示し、R⁵およびR⁶は各々独立して水素原子、ハロゲン原子、C₁～C₆アルキル基、C₃～C₆シクロアルキル基、シアノ基またはフェニル基を示し、qは0～2の整数を示す。)を示し、nは0または1の整数を示し、Arは無置換または置換されていてもよいフェニル基、ナフチル基、フリル基、チエニル基、ピロリル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアジアゾリル基、トリアゾリル基、ビリジル基、ビリダジル基、ビリミジル基、ピラジル基、キノリル基またはキノキザリル基(ただし、置換されていてもよい置換基としてはハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁～C₄アルキル基、C₁～C₄ハロアルキル基、C₁～C₄アルコキシ基、C₁～C₄ハロアルキヨ基、C₁～C₄アルキルチオ基、C₁～C₄ハロアルキルチオ基、C₁～C₄アルキルスルホニル基、C₁～C₄ハロアルキルスルホニル基、C₂～C₄アルコキシカルボニル基、カルボキシル基、アミノ基、モノC₁～C₄アルキルアミノ基、ジC₁～C₄アルキルアミノ基、フェニル基、ベンジル基、メチレンジオキシ基またはハロメチレンジオキシ基を示し、置換基が2個以上の場合には置換基は同一であっても異なっていてもよい)を示す。)を示し、mは1～5の整数(ただし、2～5の場合はYは同一であっても異なるっていてもよい)を示し、Zは酸素原子、イオウ原子またはイミノ基を示す。)で表されるテトラヒドロピリミジノン誘導体および該誘導体の1種または2種以上を有効成分として含有する有害生物防除剤に関するものである。

【0013】本明細書において示した各置換基の例を以下に示す。なお、各置換基のうち炭素鎖は、直鎖、分岐*50

*鎖又は環状の何れでもよい。以下、n-はノルマル、i-はイソ、sec-はセカンダリー、t-はターシャリ-、c-はシクロを意味する。

【0014】C₁～C₆アルキル基としては、メチル基、エチル基、n-プロピル基、i-プロピル基、c-プロピル基、n-ブチル基、i-ブチル基、sec-ブチル基、t-ブチル基、c-ブチル基、n-ペンチル基、c-ペンチル基、n-ヘキシル基、c-ヘキシル基等が挙げられる。

【0015】C₂～C₆アルケニル基としては、エテニル基、2-プロペニル基、2-メチル-2-プロペニル基、2-ブテニル基等が挙げられる。

【0016】C₂～C₆アルキニル基としては、エチニル基、2-プロピニル基、2-ブチニル基等が挙げられる。

【0017】C₂～C₆アルコキシアルキル基としては、メトキシメチル基、エトキシメチル基、1-メトキシエチル基等が挙げられる。

【0018】C₂～C₆アルキルカルボニル基としては、メチルカルボニル基、エチルカルボニル基、n-プロピルカルボニル基、i-プロピルカルボニル基、c-プロピルカルボニル基、n-ブチルカルボニル基、i-ブチルカルボニル基、sec-ブチルカルボニル基、t-ブチルカルボニル基、c-ブチルカルボニル基等が挙げられる。

【0019】C₂～C₆アルコキシカルボニル基としては、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、n-ブロポキシカルボニル基、i-ブロポキシカルボニル基、c-ブロポキシカルボニル基、n-ブトキシカルボニル基、i-ブトキシカルボニル基、sec-ブトキシカルボニル基、t-ブトキシカルボニル基、c-ブトキシカルボニル基等が挙げられる。

【0020】ハロゲン原子としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子が挙げられる。

【0021】R¹として好ましくは、水素原子又はC₁～C₆

アルキル基が挙げられる。

【0022】R²として好ましくは、水素原子又はC₁～C₆アルキル基が挙げられる。

【0023】X¹及びX²として好ましくは、ハロゲン原子、C₁～C₆ハロアルキル基またはC₁～C₆アルコキシ基が挙げられる。

【0024】Yとして好ましくは、ハロゲン原子、C₁～C₆アルキル基、C₁～C₆アルコキシ基、C₁～C₆ハロアルキル基、C₁～C₆ハロアルコキシ基、ニトロ基および置換されていてもよいビリジルオキシ基（ただし、置換されていてもよい置換基としてはハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁～C₆ハロアルキル基およびC₁～C₆ハロアルコキシ基が挙げられる）が挙げられる。

【0025】Zとして好ましくは、酸素原子が挙げられる。

【0026】Iは0～2の整数が好ましい。

【0027】mは1～3の整数が好ましい。

【0028】本発明化合物としては、下記の化合物が好ましい。R¹、R²が各々独立して水素原子またはC₁～C₆アルキル基を示し、X¹、X²がハロゲン原子、C₁～C₆ハロアルキル基またはC₁～C₆アルコキシ基を示し、Yがハロゲ

ン原子、C₁～C₆アルキル基、C₁～C₆アルコキシ基、C₁～C₆ハロアルキル基、C₁～C₆ハロアルコキシ基、ニトロ基または置換されていてもよいビリジルオキシ基（ただし、置換されていてもよい置換基としてはハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁～C₆ハロアルキル基またはC₁～C₆ハロアルコキシ基を示し、Zが酸素原子を示し、Iが0～2の整数を示し、mが1～3の整数を示す式（I）で表されるテトラヒドロピリミジノ誘導体。

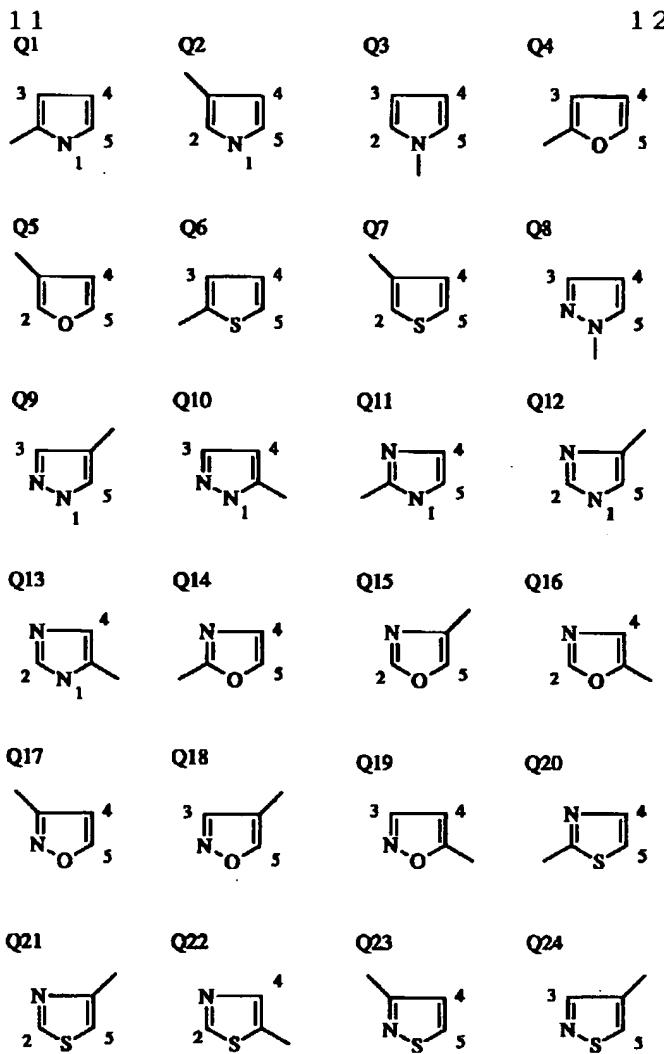
【0029】尚、本発明に包含される化合物の中で不斉炭素原子を有する化合物の場合には、光学活性な化合物S体及びR体が含まれる。更に、立体配置異性体が存在する場合には、E体及びZ体が含まれる。

【0030】本発明に包含される化合物としては、具体的には例えば、第1表に示す化合物が挙げられる。但し、第1表の化合物は例示のためのものであって、本発明はこれらのみに限定されるものではない。

【0031】第1表のQ1～Q6 Iは次の式で表される基である。

【0032】

【化7】

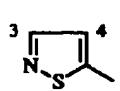


【0033】

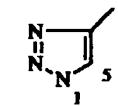
* * 【化8】

(8)

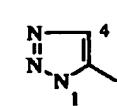
特開平8-27120

13
Q25

Q26

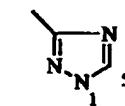


Q27

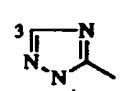


14

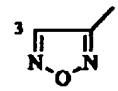
Q28



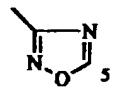
Q29



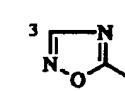
Q30



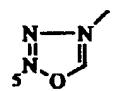
Q31



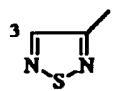
Q32



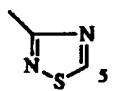
Q33



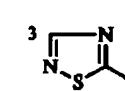
Q34



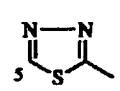
Q35



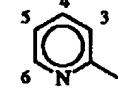
Q36



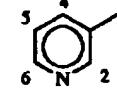
Q37



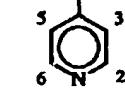
Q38



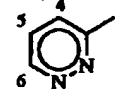
Q39



Q40



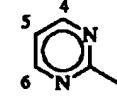
Q41



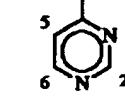
Q42



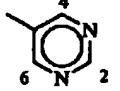
Q43



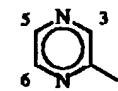
Q44



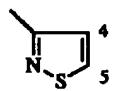
Q45



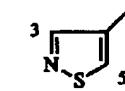
Q46



Q23

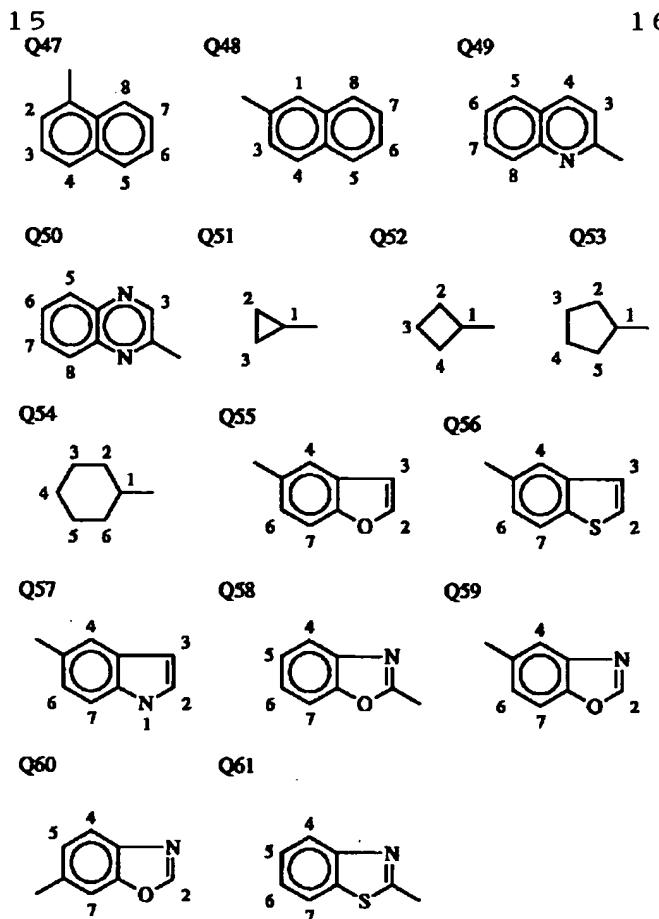


Q24



【0034】

* * 【化9】



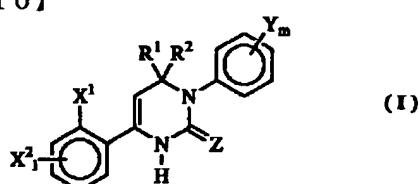
【0035】第 1 表

【0036】

【化10】

* 【0037】

【表1】



R ¹	R ²	X ¹	X ²	Y _a	Z
H	H	F	6-F	4-F	0
H	H	F	6-F	2-Cl	0
H	H	F	6-F	3-Cl	0
H	H	F	6-F	4-Cl	0
H	H	F	6-F	4-Br	0
H	H	F	6-F	4-I	0
H	H	F	6-F	4-CH ₃	0
H	H	F	6-F	4-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	0
H	H	F	6-F	4-C(CH ₃) ₃	0
H	H	F	6-F	4-CH ₂ CH=CH ₂	0
H	H	F	6-F	4-CH ₂ C≡CH	0
H	H	F	6-F	4-Q51	0

17

H	H	F	6-F	4-Q52
H	H	F	6-F	4-Q53
H	H	F	6-F	4-Q54
H	H	F	6-F	4-CHF ₂
H	H	F	6-F	4-CH ₂ Cl
H	H	F	6-F	2-CF ₃
H	H	F	6-F	3-CF ₃
H	H	F	6-F	4-CF ₃
H	H	F	6-F	4-CH=C(Cl)CF ₃
H	H	F	6-F	4-CH ₂ C≡CBr
H	H	F	6-F	4-(Q54-1-Cl)

18

0
0
0
0
0
0
0
0
0
0
0
0

【0038】

* * 【表2】

R ¹	R ²	X ¹	X ² ₁	Y _a	Z
H	H	F	6-F	4-CH ₂ CN	0
H	H	F	6-F	4-CH ₂ OH	0
H	H	F	6-F	4-CH ₂ CO ₂ H	0
H	H	F	6-F	4-OCH ₃	0
H	H	F	6-F	4-OCH ₂ CH ₃	0
H	H	F	6-F	4-OCH ₂ CH=CH ₂	0
H	H	F	6-F	4-OCH ₂ C≡CH	0
H	H	F	6-F	4-O(Q53)	0
H	H	F	6-F	4-O(Q54)	0
H	H	F	6-F	4-O(Q54-2-CH(CH ₃) ₂ -5-CH ₃)	0
H	H	F	6-F	4-OCHF ₂	0
H	H	F	6-F	4-OCF ₂ Br	0
H	H	F	6-F	2-OCF ₃	0
H	H	F	6-F	3-OCF ₃	0
H	H	F	6-F	4-OCF ₃	0
H	H	F	6-F	4-OCH ₂ CF ₃	0
H	H	F	6-F	4-OCF ₂ CHF ₂	0
H	H	F	6-F	4-OCF ₂ CHFCl	0
H	H	F	6-F	4-OCF ₂ CHFCF ₃	0
H	H	F	6-F	4-OCF ₂ CF ₂ CF ₃	0
H	H	F	6-F	4-OCH ₂ CH=CHCl	0
H	H	F	6-F	4-OCH ₂ C≡CBr	0
H	H	F	6-F	4-O(Q51-2,2-Cl ₂)	0

【0039】

* * 【表3】

R ¹	R ²	X ¹	X ² ₁	Y _a	Z
H	H	F	6-F	4-OCH ₂ (Q51-2,2-Cl ₂)	0
H	H	F	6-F	4-SCH ₃	0
H	H	F	6-F	4-SCH ₂ CH=CH ₂	0
H	H	F	6-F	4-SCH ₂ C≡CH	0
H	H	F	6-F	4-S(Q54)	0
H	H	F	6-F	4-SCHF ₂	0

19

H	H	F	6-F	4-SF ₃
H	H	F	6-F	4-SF ₂ Cl
H	H	F	6-F	4-SOCH ₃
H	H	F	6-F	4-SOCH ₂ CH=CH ₂
H	H	F	6-F	4-SO(Q54)
H	H	F	6-F	4-SOCF ₃
H	H	F	6-F	4-SO ₂ CH ₃
H	H	F	6-F	4-SO ₂ CH ₂ CH=CH ₂
H	H	F	6-F	4-SO ₂ CH ₂ C≡CH
H	H	F	6-F	4-SO ₂ (Q54)
H	H	F	6-F	4-SO ₂ CF ₃
H	H	F	6-F	4-SO ₂ CF ₂ CHFCl
H	H	F	6-F	4-CH ₂ OCH ₃
H	H	F	6-F	4-OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
H	H	F	6-F	4-CH ₂ OCH ₂ CF ₃
H	H	F	6-F	4-OCF ₂ CHFOCF ₃
H	H	F	6-F	4-CH ₂ SCH ₃

20

0
0
0
0
0
0
0
0
0
0
0
0
0
0
0
0
0
0
0
0
0

【0040】

* * 【表4】

R ¹	R ²	X ¹	X ² ₁	Y _a	Z
H	H	F	6-F	4-OCH ₂ CH ₂ SCH ₃	0
H	H	F	6-F	4-CH ₂ CO ₂ CH ₃	0
H	H	F	6-F	4-CH ₂ CO ₂ CH ₂ CF ₃	0
H	H	F	6-F	4-CH ₂ COCH ₃	0
H	H	F	6-F	4-OOC ₂ CH ₃	0
H	H	F	6-F	4-OOCCH ₃	0
H	H	F	6-F	4-COOCH ₃	0
H	H	F	6-F	4-COCH ₃	0
H	H	F	6-F	4-COCH ₂ CH=CH ₂	0
H	H	F	6-F	4-CO(Q53)	0
H	H	F	6-F	4-COCF ₃	0
H	H	F	6-F	4-CO ₂ CH ₂ CH ₃	0
H	H	F	6-F	4-CO ₂ C(CH ₃) ₃	0
H	H	F	6-F	4-CO ₂ CH ₂ CF ₃	0
H	H	F	6-F	4-OCH ₂ CO ₂ CH ₃	0
H	H	F	6-F	4-NO ₂	0
H	H	F	6-F	4-CN	0
H	H	F	6-F	4-OH	0
H	H	F	6-F	4-CO ₂ H	0
H	H	F	6-F	4-SCN	0
H	H	F	6-F	4-NCS	0
H	H	F	6-F	4-CH ₂ SCN	0
H	H	F	6-F	4-OSO ₂ CH ₃	0
H	H	F	6-F	4-CSCH ₃	0

【0041】

* * 【表5】

R ¹	R ²	X ¹	X ² ₁	Y _a	Z

21

H	H	F	6-F	4-NH ₂	0
H	H	F	6-F	4-N(CH ₃) ₂	0
H	H	F	6-F	4-N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃	0
H	H	F	6-F	4-N(CH ₃)CH ₂ CH=CHCl	0
H	H	F	6-F	4-N(CH ₃)CH ₂ C ₆ H ₅	0
H	H	F	6-F	4-CO(NH ₃) ₂	0
H	H	F	6-F	4-OCON(CH ₃) ₂	0
H	H	F	6-F	4-NHOCH ₃	0
H	H	F	6-F	4-NHO ₂ CH ₂ CH ₃	0
H	H	F	6-F	4-SO ₂ N(CH ₃) ₂	0
H	H	F	6-F	4-NHCSCH ₃	0
H	H	F	6-F	4-Si(CH ₃) ₃	0
H	H	F	6-F	3-OCH ₂ O-4	0
H	H	F	6-F	3-OCH ₂ CH ₂ O-4	0
H	H	F	6-F	3-OCF ₂ CF ₂ O-4	0
H	H	F	6-F	4-C ₆ H ₅	0
H	H	F	6-F	4-(C ₆ H ₄ -4-Cl)	0
H	H	F	6-F	4-OC ₆ H ₅	0
H	H	F	6-F	4-O(C ₆ H ₄ -4-Cl)	0
H	H	F	6-F	4-O(C ₆ H ₄ -4-CF ₃)	0
H	H	F	6-F	4-O(C ₆ H ₃ -2,4-Cl ₂)	0
H	H	F	6-F	4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0

22

【0042】

* * 【表6】

R ¹	R ²	X ¹	X ² ₁	Y _a	Z
H	H	F	6-F	3-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	H	F	6-F	4-S(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	H	F	6-F	4-NH(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	H	F	6-F	4-N(CH ₂ CH ₂ CH ₃)(C ₆ H ₄ -4-Cl)	0
H	H	F	6-F	4-CH ₂ C ₆ H ₅	0
H	H	F	6-F	4-CF ₂ (C ₆ H ₄ -4-Br)	0
H	H	F	6-F	4-COC ₆ H ₅	0
H	H	F	6-F	4-OCH ₂ (C ₆ H ₄ -4-CF ₃)	0
H	H	F	6-F	4-CH ₂ OC ₆ H ₅	0
H	H	F	6-F	4-NHCH ₂ C ₆ H ₅	0
H	H	F	6-F	4-CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	0
H	H	F	6-F	4-CH=CH(C ₆ H ₄ -4-Cl)	0
H	H	F	6-F	4-N=NC ₆ H ₅	0
H	H	F	6-F	4-OCH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	0
H	H	F	6-F	4-NHCO(NH ₃)(C ₆ H ₄ -4-Cl)	0
H	H	F	6-F	4-NHCSNH ₂ C ₆ H ₅	0
H	H	F	6-F	4-OCH ₂ CH ₂ O(C ₆ H ₃ -2,4-Cl ₂)	0
H	H	F	6-F	4-CH ₂ ON=C(Q51)(C ₆ H ₄ -4-Cl)	0
H	H	F	6-F	4-O(Q1-1-CH ₃)	0
H	H	F	6-F	4-O(Q2-1-CH ₃)	0
H	H	F	6-F	4-(Q3)	0
H	H	F	6-F	4-CH ₂ (Q4)	0

23

H H F 6-F 4-(Q5)

24

0

【0043】

* * 【表7】

R ¹	R ²	X ¹	X ² ₁	Y _n	Z
H	H	F	6-F	4-C≡C(Q6)	0
H	H	F	6-F	4-CH ₂ (Q7)	0
H	H	F	6-F	4-(Q8-3,5-(CF ₃) ₂)	0
H	H	F	6-F	4-(Q8-3-C ₆ H ₅)	0
H	H	F	6-F	4-OCH ₂ (Q9-1-CH ₃)	0
H	H	F	6-F	4-O(Q10-1-CH ₃)	0
H	H	F	6-F	4-(Q11-1-C ₆ H ₅)	0
H	H	F	6-F	4-(Q12-1-CH ₃)	0
H	H	F	6-F	4-OCH ₂ (Q13-1-CH ₃)	0
H	H	F	6-F	4-O(Q14-1-CH ₃)	0
H	H	F	6-F	4-(Q15)	0
H	H	F	6-F	4-O(Q16)	0
H	H	F	6-F	4-O(Q17-5-CH ₃)	0
H	H	F	6-F	4-O(Q18)	0
H	H	F	6-F	4-OCH ₂ (Q19)	0
H	H	F	6-F	4-OCH ₂ (Q20-4-Cl)	0
H	H	F	6-F	4-(Q21)	0
H	H	F	6-F	4-OCH ₂ (Q22)	0
H	H	F	6-F	4-(Q23)	0
H	H	F	6-F	4-OCH ₂ (Q24)	0
H	H	F	6-F	4-O(Q25-3-CH ₃)	0
H	H	F	6-F	4-(Q26-1-CH ₃)	0
H	H	F	6-F	4-OCH ₂ (Q27-1-CH ₃)	0

【0044】

* * 【表8】

R ¹	R ²	X ¹	X ² ₁	Y _n	Z
H	H	F	6-F	4-OCH ₂ (Q28-1-CH ₃)	0
H	H	F	6-F	4-O(Q29-1-CH ₃)	0
H	H	F	6-F	4-NHCONH(Q30)	0
H	H	F	6-F	4-O(Q31)	0
H	H	F	6-F	4-OCH ₂ (Q32)	0
H	H	F	6-F	4-OCH ₂ (Q33)	0
H	H	F	6-F	4-O(Q34)	0
H	H	F	6-F	4-O(Q36)	0
H	H	F	6-F	4-OCH ₂ (Q37-5-Cl)	0
H	H	F	6-F	3-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	F	6-F	4-O(Q38-3,5-Cl ₂)	0
H	H	F	6-F	4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	F	6-F	4-NH(Q38-5-CF ₃)	0
H	H	F	6-F	4-(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	F	6-F	4-O(Q39-5-Br)	0
H	H	F	6-F	4-O(Q40-2,6-Cl ₂)	0

25

H	H	F	6-F	4-O(Q41-6-Cl)	0
H	H	F	6-F	4-O(Q42)	0
H	H	F	6-F	4-O(Q43-5-Cl)	0
H	H	F	6-F	4-O(Q44)	0
H	H	F	6-F	4-O(Q45-4-CF ₃ -6-Cl)	0
H	H	F	6-F	4-O(Q46)	0
H	H	F	6-F	4-O(Q47)	0

26

【0045】

* * 【表9】

R ¹	R ²	X ¹	X ² ₁	Y _a	Z
H	H	F	6-F	4-O(Q47-4-Cl)	0
H	H	F	6-F	4-O(Q48)	0
H	H	F	6-F	4-O(Q49)	0
H	H	F	6-F	3-O(Q50-6-Cl)	0
H	H	F	6-F	3-O(Q50-6-CF ₃)	0
H	H	F	6-F	2,4-F ₂	0
H	H	F	6-F	2,3-Cl ₂	0
H	H	F	6-F	2,4-Cl ₂	0
H	H	F	6-F	2,5-Cl ₂	0
H	H	F	6-F	2,6-Cl ₂	0
H	H	F	6-F	3,4-Cl ₂	0
H	H	F	6-F	3,5-Cl ₂	0
H	H	F	6-F	3,4-Br ₂	0
H	H	F	6-F	3,4-I ₂	0
H	H	F	6-F	2,4-(CH ₃) ₂	0
H	H	F	6-F	3,4-(OCH ₃) ₂	0
H	H	F	6-F	2-F-4-Cl	0
H	H	F	6-F	2-F-4-Br	0
H	H	F	6-F	2-F-4-OCF ₃	0
H	H	F	6-F	2-F-4-OCF ₂ CHF ₂	0
H	H	F	6-F	2-F-4-O(C ₆ H ₅ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	H	F	6-F	2-F-4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	F	6-F	3-F-4-Cl	0

【0046】

* * 【表10】

R ¹	R ²	X ¹	X ² ₁	Y _a	Z
H	H	F	6-F	3-F-4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	F	6-F	2-Cl-4-CF ₃	0
H	H	F	6-F	2-Cl-4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	F	6-F	2-Cl-5-O(Q50-6-Cl)	0
H	H	F	6-F	3-Cl-4-Br	0
H	H	F	6-F	3-Cl-4-CF ₃	0
H	H	F	6-F	3-Cl-4-OCF ₃	0
H	H	F	6-F	3-Cl-4-OCF ₂ CHF ₂	0
H	H	F	6-F	3-Cl-4-O(C ₆ H ₅ -4-CF ₃)	0
H	H	F	6-F	3-Cl-4-O(C ₆ H ₅ -2-Cl-4-CF ₃)	0

27

H	H	F	6-F	3-Cl-4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	F	6-F	3-CF ₃ -4-Cl	0
H	H	F	6-F	3-CH ₃ -4-Br	0
H	H	F	6-F	3-OCH ₃ -4-CF ₃	0
H	H	F	6-F	3-CF ₃ -4-Br	0
H	H	F	6-F	3-Cl-4-I	0
H	H	F	6-F	3-Cl-4-F	0
H	H	F	6-F	3-Cl-4-Cl ₃	0
H	H	F	6-F	2,3,4-F ₃	0
H	H	F	6-F	2,4,5-F ₃	0
H	H	F	6-F	2,5-F ₂ -4-Cl	0
H	H	F	6-F	3,5-F ₂ -4-CF ₃	0
H	H	F	6-F	2,5-Cl ₂ -4-OCF ₂ CHF ₂	0

28

【0047】

* * 【表11】

R ¹	R ²	X ¹	X ² ₁	Y _a	Z
H	H	F	6-F	2,6-Cl ₂ -4-CF ₃	0
H	H	F	6-F	2,4,5-Cl ₃	0
H	H	F	6-F	3,4,5-Cl ₃	0
H	H	F	6-F	3,5-Cl ₂ -4-OCF ₃	0
H	H	F	6-F	3,5-Cl ₂ -4-OCF ₂ CHF ₂	0
H	H	F	6-F	3,5-Cl ₂ -4-O(C ₆ H ₄ -4-Cl)	0
H	H	F	6-F	3,5-Cl ₂ -4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	H	F	6-F	3,5-Cl ₂ -4-NH(C ₆ H ₄ -4-CF ₃)	0
H	H	F	6-F	3,5-Cl ₂ -4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	F	6-F	3,5-Cl ₂ -4-O(Q50-6-CF ₃)	0
H	H	F	6-F	2-F-4,5-Cl ₂	0
H	H	F	6-F	2-F-4-OCF ₂ CHF ₂ -5-Cl	0
H	H	F	6-F	2,3,4,5-F ₄	0
H	H	F	6-F	2,4-F ₂ -3,5-Cl ₂	0
H	H	F	6-F	2,6-F ₂ -3,5-Cl ₂	0
H	H	F	6-F	2,3,4,5,6-F ₅	0
H	H	F	6-F	4-OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	0
H	H	F	6-F	3-F-4-Cl ₃	0
H	H	F	6-F	2-Br-4-OCF ₃	0
H	H	F	6-F	4-(CH ₂) ₅ CH ₃	0
H	H	F	6-F	2-CH ₃ -4-OCF ₃	0
H	H	F	6-F	4-OCOC ₆ H ₅	0
H	H	F	6-F	4-OSO ₂ C ₆ H ₅	0

【0048】

* * 【表12】

R ¹	R ²	X ¹	X ² ₁	Y _a	Z
H	H	F	6-F	4-CF ₂ CF ₃	0
H	H	Cl	H	3-F	0
H	H	Cl	H	4-F	0
H	H	Cl	H	2-Cl	0

29

H	H	C1	H	3-Cl
H	H	C1	H	4-Cl
H	H	C1	H	4-Br
H	H	C1	H	4-I
H	H	C1	H	4-CH ₃
H	H	C1	H	4-C(CH ₃) ₃
H	H	C1	H	4-CHF ₂
H	H	C1	H	3-CF ₃
H	H	C1	H	4-CF ₃
H	H	C1	H	4-OCH ₃
H	H	C1	H	4-OCH ₂ CH ₃
H	H	C1	H	4-OCHF ₂
H	H	C1	H	4-OCF ₂ Br
H	H	C1	H	2-OCF ₃
H	H	C1	H	3-OCF ₃
H	H	C1	H	4-OCF ₃
H	H	C1	H	4-OCH ₂ CF ₃
H	H	C1	H	4-OCF ₂ CHF ₂
H	H	C1	H	4-OCF ₂ CHFCI

30

[0049]

* * * 【表13】

R ¹	R ²	X ¹	X ² ₁	Y _a	Z
H	H	Cl	H	4-SCH ₃	0
H	H	Cl	H	4-SCHF ₂	0
H	H	Cl	H	4-SCF ₃	0
H	H	Cl	H	4-SCF ₂ Cl	0
H	H	Cl	H	4-SOCH ₃	0
H	H	Cl	H	4-SOCF ₃	0
H	H	Cl	H	4-SO ₂ CH ₃	0
H	H	Cl	H	4-SO ₂ CF ₃	0
H	H	Cl	H	4-SO ₂ CF ₂ CHFC1	0
H	H	Cl	H	4-OCF ₂ CHFOCF ₃	0
H	H	Cl	H	4-COOCH ₃	0
H	H	Cl	H	4-COCF ₃	0
H	H	Cl	H	4-CO ₂ CH ₂ CH ₃	0
H	H	Cl	H	4-NO ₂	0
H	H	Cl	H	4-CN	0
H	H	Cl	H	4-CO ₂ H	0
H	H	Cl	H	4-N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃	0
H	H	Cl	H	4-NHODCH ₃	0
H	H	Cl	H	3-OCH ₂ O-4	0
H	H	Cl	H	3-OCF ₂ O-4	0
H	H	Cl	H	3-OCF ₂ CF ₂ O-4	0
H	H	Cl	H	4-C ₆ H ₅	0
H	H	Cl	H	4-(C ₆ H ₄ -4-Cl)	0

【0050】

※ ※ 【表14】

3 1

3 2

R ¹	R ²	X ¹	X ² ₁	Y _a	Z
H	H	C1	H	4-O(C ₆ H ₄ -4-Cl)	0
H	H	C1	H	4-O(C ₆ H ₄ -4-CF ₃)	0
H	H	C1	H	4-O(C ₆ H ₃ -2,4-Cl ₂)	0
H	H	C1	H	4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	H	C1	H	3-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	H	C1	H	4-OCH ₂ (C ₆ H ₄ -4-CF ₃)	0
H	H	C1	H	4-CH ₂ ON=C(Q51)(C ₆ H ₄ -4-Cl)	0
H	H	C1	H	3-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	C1	H	4-O(Q38-3,5-Cl ₂)	0
H	H	C1	H	4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	C1	H	4-(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	C1	H	4-O(Q39-5-Br)	0
H	H	C1	H	4-O(Q40-2,6-Cl ₂)	0
H	H	C1	H	4-O(Q45-4-CF ₃ -6-Cl)	0
H	H	C1	H	3-O(Q50-6-Cl)	0
H	H	C1	H	2,4-F ₂	0
H	H	C1	H	2,4-Cl ₂	0
H	H	C1	H	2,5-Cl ₂	0
H	H	C1	H	3,4-Cl ₂	0
H	H	C1	H	3,5-Cl ₂	0
H	H	C1	H	3,4-Br ₂	0
H	H	C1	H	2-F-4-Cl	0
H	H	C1	H	2-F-4-Br	0

【0051】

* * 【表15】

R ¹	R ²	X ¹	X ² ₁	Y _a	Z
H	H	C1	H	2-F-4-OCF ₃	0
H	H	C1	H	2-F-4-OCF ₂ CHF ₂	0
H	H	C1	H	2-F-4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	H	C1	H	2-F-4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	C1	H	3-F-4-Cl	0
H	H	C1	H	3-F-4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	C1	H	2-Cl-4-CF ₃	0
H	H	C1	H	2-Cl-4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	C1	H	3-Cl-4-Br	0
H	H	C1	H	3-Cl-4-CF ₃	0
H	H	C1	H	3-Cl-4-OCF ₃	0
H	H	C1	H	3-Cl-4-OCF ₂ CHF ₂	0
H	H	C1	H	3-Cl-4-O(C ₆ H ₄ -4-CF ₃)	0
H	H	C1	H	3-Cl-4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	H	C1	H	3-Cl-4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	C1	H	3-Cl-4-I	0
H	H	C1	H	2,3,4-F ₃	0
H	H	C1	H	2,4,5-F ₃	0
H	H	C1	H	2,5-F ₂ -4-Cl	0
H	H	C1	H	2-F-4,5-Cl ₂	0

33

H	H	Cl	H	2,5-Cl ₂ -4-OCF ₂ CHF ₂	0
H	H	Cl	H	2,4,5-Cl ₃	0
H	H	Cl	H	3,4,5-Cl ₃	0

【0052】

* * 【表16】

R ¹	R ²	X ¹	X ² ₁	Y _a	Z
H	H	Cl	H	3,5-Cl ₂ -4-OCF ₃	0
H	H	Cl	H	3,5-Cl ₂ -4-OCF ₂ CHF ₂	0
H	H	Cl	H	3,5-Cl ₂ -4-O(C ₆ H ₄ -4-Cl)	0
H	H	Cl	H	3,5-Cl ₂ -4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	H	Cl	H	3,5-Cl ₂ -4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	Cl	H	3,5-Cl ₂ -4-O(Q50-6-CF ₃)	0
H	H	Cl	H	2,4-F ₂ -3,5-Cl ₂	0
H	H	Cl	H	2,3,4,5,6-F ₅	0
H	H	Cl	H	4-CF ₂ CF ₃	0
H	H	F	H	4-F	0
H	H	F	H	4-Cl	0
H	H	F	H	4-Br	0
H	H	F	H	4-I	0
H	H	F	H	4-CF ₃	0
H	H	F	H	4-OCHF ₂	0
H	H	F	H	4-OCF ₂ Br	0
H	H	F	H	3-OCF ₃	0
H	H	F	H	4-OCF ₃	0
H	H	F	H	4-OCF ₂ CHF ₂	0
H	H	F	H	4-SOF ₃	0
H	H	F	H	4-SO ₂ CH ₃	0
H	H	F	H	4-SO ₂ CF ₃	0
H	H	F	H	4-NO ₂	0

【0053】

* * 【表17】

R ¹	R ²	X ¹	X ² ₁	Y _a	Z
H	H	F	H	4-CN	0
H	H	F	H	3-OCF ₂ O-4	0
H	H	F	H	4-(C ₆ H ₄ -4-Cl)	0
H	H	F	H	4-O(C ₆ H ₄ -4-CF ₃)	0
H	H	F	H	4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	H	F	H	4-CH ₂ ON=C(Q51)(C ₆ H ₄ -4-Cl)	0
H	H	F	H	4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	F	H	4-(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	F	H	3-O(Q50-6-Cl)	0
H	H	F	H	2,4-F ₂	0
H	H	F	H	2,4-Cl ₂	0
H	H	F	H	3,4-Cl ₂	0
H	H	F	H	3,5-Cl ₂	0
H	H	F	H	3,4-Br ₂	0

35

H	H	F	H	2-F-4-Cl	0
H	H	F	H	2-F-4-Br	0
H	H	F	H	2-F-4-OCF ₃	0
H	H	F	H	2-F-4-OCF ₂ CHF ₂	0
H	H	F	H	2-F-4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	H	F	H	2-F-4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	F	H	3-F-4-Cl	0
H	H	F	H	3-Cl-4-Br	0
H	H	F	H	3-Cl-4-CF ₃	0

36

【0054】

* * 【表18】

R ¹	R ²	X ¹	X ² ₁	Y _a	Z
H	H	F	H	3-Cl-4-OCF ₃	0
H	H	F	H	3-Cl-4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	H	F	H	3-Cl-4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	F	H	3-Cl-4-I	0
H	H	F	H	2,3,4-F ₃	0
H	H	F	H	2,4,5-F ₃	0
H	H	F	H	2,5-F ₂ -4-Cl	0
H	H	F	H	2-F-4,5-Cl ₂	0
H	H	F	H	2,4,5-Cl ₃	0
H	H	F	H	3,4,5-Cl ₃	0
H	H	F	H	3,5-Cl ₂ -4-OCF ₂ CHF ₂	0
H	H	F	H	3,5-Cl ₂ -4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	H	F	H	3,5-Cl ₂ -4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	F	H	2,4-F ₂ -3,5-Cl ₂	0
H	H	F	H	4-CF ₂ CF ₃	0
H	H	Cl	6-F	4-F	0
H	H	Cl	6-F	4-Cl	0
H	H	Cl	6-F	4-Br	0
H	H	Cl	6-F	4-I	0
H	H	Cl	6-F	4-CF ₃	0
H	H	Cl	6-F	4-OCHF ₂	0
H	H	Cl	6-F	4-OCF ₂ Br	0
H	H	Cl	6-F	4-OCF ₃	0

【0055】

* * 【表19】

R ¹	R ²	X ¹	X ² ₁	Y _a	Z
H	H	Cl	6-F	4-OCF ₂ CHF ₂	0
H	H	Cl	6-F	4-SCF ₃	0
H	H	Cl	6-F	4-SO ₂ CF ₃	0
H	H	Cl	6-F	4-NO ₂	0
H	H	Cl	6-F	4-CN	0
H	H	Cl	6-F	3-OCF ₂ O-4	0
H	H	Cl	6-F	4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	H	Cl	6-F	4-CH ₂ ON=C(Q51)(C ₆ H ₄ -4-Cl)	0

37

H	H	C1	6-F	4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	C1	6-F	3,4-Cl ₂	0
H	H	C1	6-F	3,5-Cl ₂	0
H	H	C1	6-F	3,4-Br ₂	0
H	H	C1	6-F	2-F-4-Cl	0
H	H	C1	6-F	2-F-4-Br	0
H	H	C1	6-F	2-F-4-OCF ₃	0
H	H	C1	6-F	2-F-4-OCF ₂ CHF ₂	0
H	H	C1	6-F	2-F-4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	H	C1	6-F	2-F-4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	C1	6-F	3-F-4-Cl	0
H	H	C1	6-F	3-Cl-4-Br	0
H	H	C1	6-F	3-Cl-4-OCF ₃	0
H	H	C1	6-F	2,5-F ₂ -4-Cl	0
H	H	C1	6-F	2-F-4,5-Cl ₂	0

38

【0056】

* * 【表20】

R ¹	R ²	X ¹	X ² ₁	Y _a	Z
H	H	C1	6-F	3,4,5-Cl ₃	0
H	H	C1	6-F	3,5-Cl ₂ -4-OCF ₂ CHF ₂	0
H	H	C1	6-F	3,5-Cl ₂ -4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	C1	6-F	2,4-F ₂ -3,5-Cl ₂	0
H	H	C1	6-F	4-CF ₂ CF ₃	0
H	H	C1	6-Cl	4-F	0
H	H	C1	6-Cl	4-Cl	0
H	H	C1	6-Cl	4-Br	0
H	H	C1	6-Cl	4-I	0
H	H	C1	6-Cl	4-CF ₃	0
H	H	C1	6-Cl	4-OCHF ₂	0
H	H	C1	6-Cl	4-OCF ₂ Br	0
H	H	C1	6-Cl	4-OCF ₃	0
H	H	C1	6-Cl	4-OCF ₂ CHF ₂	0
H	H	C1	6-Cl	4-SCF ₃	0
H	H	C1	6-Cl	4-SO ₂ CF ₃	0
H	H	C1	6-Cl	4-NO ₂	0
H	H	C1	6-Cl	4-CN	0
H	H	C1	6-Cl	3-OCF ₂ O-4	0
H	H	C1	6-Cl	4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	H	C1	6-Cl	4-CH ₂ ON=C(Q51)(C ₆ H ₄ -4-Cl)	0
H	H	C1	6-Cl	4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	C1	6-Cl	3,4-Cl ₂	0

【0057】

* * 【表21】

R ¹	R ²	X ¹	X ² ₁	Y _a	Z
H	H	C1	6-Cl	3,5-Cl ₂	0
H	H	C1	6-Cl	3,4-Br ₂	0

39

H	H	Cl	6-Cl	2-F-4-Cl	0
H	H	Cl	6-Cl	2-F-4-Br	0
H	H	Cl	6-Cl	2-F-4-OCF ₃	0
H	H	Cl	6-Cl	2-F-4-OCF ₂ CHF ₂	0
H	H	Cl	6-Cl	2-F-4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	H	Cl	6-Cl	2-F-4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	Cl	6-Cl	3-F-4-Cl	0
H	H	Cl	6-Cl	3-Cl-4-Br	0
H	H	Cl	6-Cl	3-Cl-4-OCF ₃	0
H	H	Cl	6-Cl	2,5-F ₂ -4-Cl	0
H	H	Cl	6-Cl	2-F-4,5-Cl ₂	0
H	H	Cl	6-Cl	3,4,5-Cl ₃	0
H	H	Cl	6-Cl	3,5-Cl ₂ -4-OCF ₂ CHF ₂	0
H	H	Cl	6-Cl	3,5-Cl ₂ -4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	Cl	6-Cl	2,4-F ₂ -3,5-Cl ₂	0
H	H	Cl	6-Cl	4-CF ₂ CF ₃	0
H	H	Br	H	4-Cl	0
H	H	Br	H	4-Br	0
H	H	Br	H	4-CF ₃	0
H	H	Br	H	4-OCF ₃	0
H	H	Br	H	4-OCF ₂ CHF ₂	0

40

【0058】

* * 【表22】

R ¹	R ²	X ¹	X ² ₁	Y _a	Z
H	H	Br	H	3-OCF ₂ O-4	0
H	H	Br	H	4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	H	Br	H	4-CH ₂ ON=C(Q51)(C ₆ H ₄ -4-Cl)	0
H	H	Br	H	4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	Br	H	3,4-Cl ₂	0
H	H	Br	H	3,5-Cl ₂	0
H	H	Br	H	3,4-Br ₂	0
H	H	Br	H	2-F-4-Cl	0
H	H	Br	H	2-F-4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	H	Br	H	2-F-4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	Br	H	3-F-4-Cl	0
H	H	Br	H	3-Cl-4-Br	0
H	H	Br	H	2,5-F ₂ -4-Cl	0
H	H	Br	H	3,4,5-Cl ₃	0
H	H	Br	H	3,5-Cl ₂ -4-OCF ₂ CHF ₂	0
H	H	Br	H	3,5-Cl ₂ -4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	Br	H	2,4-F ₂ -3,5-Cl ₂	0
H	H	CH ₃	H	4-Cl	0
H	H	CH ₃	H	4-Br	0
H	H	CH ₃	H	4-CF ₃	0
H	H	CH ₃	H	4-OCF ₃	0
H	H	CH ₃	H	4-OCF ₂ CHF ₂	0
H	H	CH ₃	H	3-OCF ₂ O-4	0

41

【0059】

* * 【表23】

R ¹	R ²	X ¹	X ² ₁	Y _a	Z
H	H	CH ₃	H	4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	H	CH ₃	H	4-CH ₂ ON=C(Q51)(C ₆ H ₄ -4-Cl)	0
H	H	CH ₃	H	4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	CH ₃	H	3,4-Cl ₂	0
H	H	CH ₃	H	3,5-Cl ₂	0
H	H	CH ₃	H	3,4-Br ₂	0
H	H	CH ₃	H	2-F-4-Cl	0
H	H	CH ₃	H	2-F-4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	H	CH ₃	H	2-F-4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	CH ₃	H	3-F-4-Cl	0
H	H	CH ₃	H	3-Cl-4-Br	0
H	H	CH ₃	H	2,5-F ₂ -4-Cl	0
H	H	CH ₃	H	3,4,5-Cl ₃	0
H	H	CH ₃	H	3,5-Cl ₂ -4-OCF ₂ CHF ₂	0
H	H	CH ₃	H	3,5-Cl ₂ -4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	CH ₃	H	2,4-F ₂ -3,5-Cl ₂	0
H	H	OCH ₃	H	4-Cl	0
H	H	OCH ₃	H	4-Br	0
H	H	OCH ₃	H	4-CF ₃	0
H	H	OCH ₃	H	4-OCF ₃	0
H	H	OCH ₃	H	4-OCF ₂ CHF ₂	0
H	H	OCH ₃	H	3-OCF ₂ O-4	0
H	H	OCH ₃	H	4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0

【0060】

* * 【表24】

R ¹	R ²	X ¹	X ² ₁	Y _a	Z
H	H	OCH ₃	H	4-CH ₂ ON=C(Q51)(C ₆ H ₄ -4-Cl)	0
H	H	OCH ₃	H	4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	OCH ₃	H	3,4-Cl ₂	0
H	H	OCH ₃	H	3,5-Cl ₂	0
H	H	OCH ₃	H	3,4-Br ₂	0
H	H	OCH ₃	H	2-F-4-Cl	0
H	H	OCH ₃	H	2-F-4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	H	OCH ₃	H	2-F-4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	OCH ₃	H	3-F-4-Cl	0
H	H	OCH ₃	H	3-Cl-4-Br	0
H	H	OCH ₃	H	2,5-F ₂ -4-Cl	0
H	H	OCH ₃	H	3,4,5-Cl ₃	0
H	H	OCH ₃	H	3,5-Cl ₂ -4-OCF ₂ CHF ₂	0
H	H	OCH ₃	H	3,5-Cl ₂ -4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	CF ₃	H	2,4-F ₂ -3,5-Cl ₂	0
H	H	CF ₃	H	4-Cl	0
H	H	CF ₃	H	4-Br	0
H	H	CF ₃	H	4-CF ₃	0

43

H	H	CF ₃	H	4-OCF ₃	0
H	H	CF ₃	H	4-OCF ₂ CHF ₂	0
H	H	CF ₃	H	3-OCF ₂ O-4	0
H	H	CF ₃	H	4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	H	CF ₃	H	4-CH ₂ ON=C(Q51)(C ₆ H ₄ -4-Cl)	0

44

【0061】

* * 【表25】

R ¹	R ²	X ¹	X ² ₁	Y _a	Z
H	H	CF ₃	H	4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	CF ₃	H	3,4-Cl ₂	0
H	H	CF ₃	H	3,5-Cl ₂	0
H	H	CF ₃	H	3,4-Br ₂	0
H	H	CF ₃	H	2-F-4-Cl	0
H	H	CF ₃	H	2-F-4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	H	CF ₃	H	2-F-4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	CF ₃	H	3-F-4-Cl	0
H	H	CF ₃	H	3-Cl-4-Br	0
H	H	CF ₃	H	2,5-F ₂ -4-Cl	0
H	H	CF ₃	H	3,4,5-Cl ₃	0
H	H	CF ₃	H	3,5-Cl ₂ -4-OCF ₂ CHF ₂	0
H	H	CF ₃	H	3,5-Cl ₂ -4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	CF ₃	H	2,4-F ₂ -3,5-Cl ₂	0
H	H	F	4,6-F ₂	4-Cl	0
H	H	F	4,6-F ₂	4-Br	0
H	H	F	4,6-F ₂	4-CF ₃	0
H	H	F	4,6-F ₂	4-OCF ₃	0
H	H	F	4,6-F ₂	4-OCF ₂ CHF ₂	0
H	H	F	4,6-F ₂	3-OCF ₂ O-4	0
H	H	F	4,6-F ₂	4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	H	F	4,6-F ₂	4-CH ₂ ON=C(Q51)(C ₆ H ₄ -4-Cl)	0
H	H	F	4,6-F ₂	4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0

【0062】

* * 【表26】

R ¹	R ²	X ¹	X ² ₁	Y _a	Z
H	H	F	4,6-F ₂	3,4-Cl ₂	0
H	H	F	4,6-F ₂	3,5-Cl ₂	0
H	H	F	4,6-F ₂	3,4-Br ₂	0
H	H	F	4,6-F ₂	2-F-4-Cl	0
H	H	F	4,6-F ₂	2-F-4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	H	F	4,6-F ₂	2-F-4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	F	4,6-F ₂	3-F-4-Cl	0
H	H	F	4,6-F ₂	3-Cl-4-Br	0
H	H	F	4,6-F ₂	2,5-F ₂ -4-Cl	0
H	H	F	4,6-F ₂	3,4,5-Cl ₃	0
H	H	F	4,6-F ₂	3,5-Cl ₂ -4-OCF ₂ CHF ₂	0
H	H	F	4,6-F ₂	3,5-Cl ₂ -4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0

45

H	H	F	4,6-F ₂	2,4-F ₂ -3,5-Cl ₂	0
H	H	F	4-F	4-Cl	0
H	H	F	4-F	4-Br	0
H	H	F	4-F	4-CF ₃	0
H	H	F	4-F	4-OCF ₃	0
H	H	F	4-F	4-OCF ₂ CHF ₂	0
H	H	F	4-F	3-OCF ₂ O-4	0
H	H	F	4-F	4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	H	F	4-F	4-CH ₂ ON=C(Q51)(C ₆ H ₄ -4-Cl)	0
H	H	F	4-F	4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	F	4-F	3,4-Cl ₂	0

46

【0063】

* * 【表27】

R ¹	R ²	X ¹	X ² ₁	Y _a	Z
H	H	F	4-F	3,5-Cl ₂	0
H	H	F	4-F	3,4-Br ₂	0
H	H	F	4-F	2-F-4-Cl	0
H	H	F	4-F	2-F-4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	H	F	4-F	2-F-4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	F	4-F	3-F-4-Cl	0
H	H	F	4-F	3-Cl-4-Br	0
H	H	F	4-F	2,5-F ₂ -4-Cl	0
H	H	F	4-F	3,4,5-Cl ₃	0
H	H	F	4-F	3,5-Cl ₂ -4-OCF ₂ CHF ₂	0
H	H	F	4-F	3,5-Cl ₂ -4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	F	4-F	2,4-F ₂ -3,5-Cl ₂	0
H	H	Cl	4-F	4-Cl	0
H	H	Cl	4-F	4-Br	0
H	H	Cl	4-F	4-CF ₃	0
H	H	Cl	4-F	4-OCF ₃	0
H	H	Cl	4-F	4-OCF ₂ CHF ₂	0
H	H	Cl	4-F	3-OCF ₂ O-4	0
H	H	Cl	4-F	4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	H	Cl	4-F	4-CH ₂ ON=C(Q51)(C ₆ H ₄ -4-Cl)	0
H	H	Cl	4-F	4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	Cl	4-F	3,4-Cl ₂	0
H	H	Cl	4-F	3,5-Cl ₂	0

【0064】

* * 【表28】

R ¹	R ²	X ¹	X ² ₁	Y _a	Z
H	H	Cl	4-F	3,4-Br ₂	0
H	H	Cl	4-F	2-F-4-Cl	0
H	H	Cl	4-F	2-F-4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	H	Cl	4-F	2-F-4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	Cl	4-F	3-F-4-Cl	0
H	H	Cl	4-F	3-Cl-4-Br	0

47

H	H	Cl	4-F	2,5-F ₂ -4-Cl	0
H	H	Cl	4-F	3,4,5-Cl ₃	0
H	H	Cl	4-F	3,5-Cl ₂ -4-OCF ₂ CHF ₂	0
H	H	Cl	4-F	3,5-Cl ₂ -4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	Cl	4-F	2,4-F ₂ -3,5-Cl ₂	0
H	H	I	H	4-Cl	0
H	H	I	H	4-CF ₃	0
H	H	I	H	4-OCF ₃	0
H	H	I	H	4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	I	H	3,4-Cl ₂	0
H	H	I	H	2-F-4-Cl	0
H	H	I	H	2-F-4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	H	CH(CH ₃) ₂	H	4-Cl	0
H	H	CH(CH ₃) ₂	H	4-CF ₃	0
H	H	CH(CH ₃) ₂	H	4-OCF ₃	0
H	H	CH(CH ₃) ₂	H	4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	CH(CH ₃) ₂	H	3,4-Cl ₂	0

48

【0065】

* * 【表29】

R ¹	R ²	X ¹	X ² ₁	Y _a	Z
H	H	CH(CH ₃) ₂	H	2-F-4-Cl	0
H	H	CH(CH ₃) ₂	H	2-F-4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	H	CN	H	4-Cl	0
H	H	CN	H	4-CF ₃	0
H	H	CN	H	4-OCF ₃	0
H	H	CN	H	4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	CN	H	3,4-Cl ₂	0
H	H	CN	H	2-F-4-Cl	0
H	H	CN	H	2-F-4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	H	NO ₂	H	4-Cl	0
H	H	NO ₂	H	4-CF ₃	0
H	H	NO ₂	H	4-OCF ₃	0
H	H	NO ₂	H	4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	NO ₂	H	3,4-Cl ₂	0
H	H	NO ₂	H	2-F-4-Cl	0
H	H	NO ₂	H	2-F-4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	H	F	6-F-3-NH ₂	4-Cl	0
H	H	F	6-F-3-NH ₂	4-CF ₃	0
H	H	F	6-F-3-NH ₂	4-OCF ₃	0
H	H	F	6-F-3-NH ₂	4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	F	6-F-3-NH ₂	3,4-Cl ₂	0
H	H	F	6-F-3-NH ₂	2-F-4-Cl	0
H	H	F	6-F-3-NH ₂	2-F-4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0

【0066】

※ ※ 【表30】

R ¹	R ²	X ¹	X ² ₁	Y _a	Z

49

50

H	H	SCH ₃	H	4-Cl	0
H	H	SCH ₃	H	4-CF ₃	0
H	H	SCH ₃	H	4-OCF ₃	0
H	H	SCH ₃	H	4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	SCH ₃	H	3,4-Cl ₂	0
H	H	SCH ₃	H	2-F-4-Cl	0
H	H	SCH ₃	H	2-F-4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	H	OCHF ₂	H	4-Cl	0
H	H	OCHF ₂	H	4-CF ₃	0
H	H	OCHF ₂	H	4-OCF ₃	0
H	H	OCHF ₂	H	4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	OCHF ₂	H	3,4-Cl ₂	0
H	H	OCHF ₂	H	2-F-4-Cl	0
H	H	OCHF ₂	H	2-F-4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	H	OCHF ₂	H	4-Cl	0
H	H	OCHF ₂	H	4-CF ₃	0
H	H	OCF ₃	H	4-OCF ₃	0
H	H	OCF ₃	H	4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	OCF ₃	H	3,4-Cl ₂	0
H	H	OCF ₃	H	2-F-4-Cl	0
H	H	OCF ₃	H	2-F-4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	H	SCF ₃	H	4-Cl	0
H	H	SCF ₃	H	4-CF ₃	0

【0067】

* * 【表31】

R ¹	R ²	X ¹	X ² ₁	Y _a	Z
H	H	SCF ₃	H	4-OCF ₃	0
H	H	SCF ₃	H	4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	SCF ₃	H	3,4-Cl ₂	0
H	H	SCF ₃	H	2-F-4-Cl	0
H	H	SCF ₃	H	2-F-4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	H	Br	6-F	4-Cl	0
H	H	Br	6-F	4-CF ₃	0
H	H	Br	6-F	4-OCF ₃	0
H	H	Br	6-F	4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	Br	6-F	3,4-Cl ₂	0
H	H	Br	6-F	2-F-4-Cl	0
H	H	Br	6-F	2-F-4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	H	F	3,6-F ₂	4-Cl	0
H	H	F	3,6-F ₂	4-CF ₃	0
H	H	F	3,6-F ₂	4-OCF ₃	0
H	H	F	3,6-F ₂	4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	F	3,6-F ₂	3,4-Cl ₂	0
H	H	F	3,6-F ₂	2-F-4-Cl	0
H	H	F	3,6-F ₂	2-F-4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	H	F	4-F-6-Cl	4-Cl	0
H	H	F	4-F-6-Cl	4-CF ₃	0
H	H	F	4-F-6-Cl	4-OCF ₃	0

51

H H F 4-F-6-Cl 4-O(Q38-3-Cl-5-CF₃)

52

0

【0068】

* * 【表32】

R ¹	R ²	X ¹	X ² ₁	Y _a	Z
H	H	F	4-F-6-Cl	3,4-Cl ₂	0
H	H	F	4-F-6-Cl	2-F-4-Cl	0
H	H	F	4-F-6-Cl	2-F-4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	H	F	5-F	4-Cl	0
H	H	F	5-F	4-CF ₃	0
H	H	F	5-F	4-OCF ₃	0
H	H	F	5-F	4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	F	5-F	3,4-Cl ₂	0
H	H	F	5-F	2-F-4-Cl	0
H	H	F	5-F	2-F-4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	H	OCH ₃	6-OCH ₃	4-Cl	0
H	H	OCH ₃	6-OCH ₃	4-CF ₃	0
H	H	OCH ₃	6-OCH ₃	4-OCF ₃	0
H	H	OCH ₃	6-OCH ₃	4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	OCH ₃	6-OCH ₃	3,4-Cl ₂	0
H	H	OCH ₃	6-OCH ₃	2-F-4-Cl	0
H	H	OCH ₃	6-OCH ₃	2-F-4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	H	Cl	4-Cl	4-Cl	0
H	H	Cl	4-Cl	4-CF ₃	0
H	H	Cl	4-Cl	4-OCF ₃	0
H	H	Cl	4-Cl	4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	H	Cl	4-Cl	3,4-Cl ₂	0
H	H	Cl	4-Cl	2-F-4-Cl	0

【0069】

* * 【表33】

R ¹	R ²	X ¹	X ² ₁	Y _a	Z
H	H	Cl	4-Cl	2-F-4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	CH ₃	F	6-F	4-Cl	0
H	CH ₃	F	6-F	4-Br	0
H	CH ₃	F	6-F	4-CF ₃	0
H	CH ₃	F	6-F	4-OCF ₃	0
H	CH ₃	F	6-F	4-OCF ₂ CHF ₂	0
H	CH ₃	F	6-F	3-OCF ₂ O-4	0
H	CH ₃	F	6-F	4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	CH ₃	F	6-F	4-CH ₂ ON=C(Q51)(C ₆ H ₄ -4-Cl)	0
H	CH ₃	F	6-F	4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	CH ₃	F	6-F	3,4-Cl ₂	0
H	CH ₃	F	6-F	3,5-Cl ₂	0
H	CH ₃	F	6-F	3,4-Br ₂	0
H	CH ₃	F	6-F	2-F-4-Cl	0
H	CH ₃	F	6-F	2-F-4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	CH ₃	F	6-F	2-F-4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0

53

H	CH ₃	F	6-F	3-F-4-Cl	0
H	CH ₃	F	6-F	3-Cl-4-Br	0
H	CH ₃	F	6-F	2,5-F ₂ -4-Cl	0
H	CH ₃	F	6-F	3,4,5-Cl ₃	0
H	CH ₃	F	6-F	3,5-Cl ₂ -4-OCF ₂ CHF ₂	0
H	CH ₃	F	6-F	3,5-Cl ₂ -4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-ClF ₃)	0
H	CH ₃	F	6-F	2,4-F ₂ -3,5-Cl ₂	0

54

【0070】

* * 【表34】

R ¹	R ²	X ¹	X ² ₁	Y _a	Z
H	H	F	6-F	4-Cl	S
H	H	F	6-F	4-Br	S
H	H	F	6-F	4-CF ₃	S
H	H	F	6-F	4-OCF ₃	S
H	H	F	6-F	4-OCF ₂ CHF ₂	S
H	H	F	6-F	3-OCF ₂ O-4	S
H	H	F	6-F	4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-ClF ₃)	S
H	H	F	6-F	4-CH ₂ ON=C(Q51)(C ₆ H ₄ -4-Cl)	S
H	H	F	6-F	4-O(Q38-3-Cl-5-ClF ₃)	S
H	H	F	6-F	3,4-Cl ₂	S
H	H	F	6-F	3,5-Cl ₂	S
H	H	F	6-F	3,4-Br ₂	S
H	H	F	6-F	2-F-4-Cl	S
H	H	F	6-F	2-F-4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-ClF ₃)	S
H	H	F	6-F	2-F-4-O(Q38-3-Cl-5-ClF ₃)	S
H	H	F	6-F	3-F-4-Cl	S
H	H	F	6-F	3-Cl-4-Br	S
H	H	F	6-F	2,5-F ₂ -4-Cl	S
H	H	F	6-F	3,4,5-Cl ₃	S
H	H	F	6-F	3,5-Cl ₂ -4-OCF ₂ CHF ₂	S
H	H	F	6-F	3,5-Cl ₂ -4-O(Q38-3-Cl-5-ClF ₃)	S
H	H	F	6-F	2,4-F ₂ -3,5-Cl ₂	S
H	CH ₂ CH ₃	F	6-F	4-Cl	0

【0071】

* * 【表35】

R ¹	R ²	X ¹	X ² ₁	Y _a	Z
H	CH ₂ CH ₃	F	6-F	4-Br	0
H	CH ₂ CH ₃	F	6-F	4-CF ₃	0
H	CH ₂ CH ₃	F	6-F	4-OCF ₃	0
H	CH ₂ CH ₃	F	6-F	4-OCF ₂ CHF ₂	0
H	CH ₂ CH ₃	F	6-F	3-OCF ₂ O-4	0
H	CH ₂ CH ₃	F	6-F	4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-ClF ₃)	0
H	CH ₂ CH ₃	F	6-F	4-CH ₂ ON=C(Q51)(C ₆ H ₄ -4-Cl)	0
H	CH ₂ CH ₃	F	6-F	4-O(Q38-3-Cl-5-ClF ₃)	0
H	CH ₂ CH ₃	F	6-F	3,4-Cl ₂	0
H	CH ₂ CH ₃	F	6-F	3,5-Cl ₂	0

55

H	CH ₂ CH ₃	F	6-F	3,4-Br ₂	0
H	CH ₂ CH ₃	F	6-F	2-F-4-Cl	0
H	CH ₂ CH ₃	F	6-F	2-F-4-O(C ₆ H ₅ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	CH ₂ CH ₃	F	6-F	2-F-4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	CH ₂ CH ₃	F	6-F	3-F-4-Cl	0
H	CH ₂ CH ₃	F	6-F	3-Cl-4-Br	0
H	CH ₂ CH ₃	F	6-F	2,5-F ₂ -4-Cl	0
H	CH ₂ CH ₃	F	6-F	3,4,5-Cl ₃	0
H	CH ₂ CH ₃	F	6-F	3,5-Cl ₂ -4-OCF ₂ CHF ₂	0
H	CH ₂ CH ₃	F	6-F	3,5-Cl ₂ -4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	CH ₂ CH ₃	F	6-F	2,4-F ₂ -3,5-Cl ₂	0
H	H	F	6-F	4-OCF ₃	NH
H	H	F	6-F	4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	NH

56

【0072】

* * 【表36】

R ¹	R ²	X ¹	X ² ₁	Y _n	Z
H	H	F	6-F	3,4-Cl ₂	NH
H	H	F	6-F	2-F-4-Cl	NH
H	H	F	6-F	2-F-4-O(C ₆ H ₅ -2-Cl-4-CF ₃)	NH
H	H	F	6-F	4-Cl	NH
H	H	F	6-F	4-CF ₃	NH
H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	F	6-F	4-OCF ₃	0
H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	F	6-F	4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	F	6-F	3,4-Cl ₂	0
H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	F	6-F	2-F-4-Cl	0
H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	F	6-F	2-F-4-O(C ₆ H ₅ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	F	6-F	4-Cl	0
H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	F	6-F	4-CF ₃	0
CH ₃	CH ₃	F	6-F	4-OCF ₃	0
CH ₃	CH ₃	F	6-F	4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
CH ₃	CH ₃	F	6-F	3,4-Cl ₂	0
CH ₃	CH ₃	F	6-F	2-F-4-Cl	0
CH ₃	CH ₃	F	6-F	2-F-4-O(C ₆ H ₅ -2-Cl-4-CF ₃)	0
CH ₃	CH ₃	F	6-F	4-Cl	0
CH ₃	CH ₃	F	6-F	4-CF ₃	0
H	C ₆ H ₅	F	6-F	4-OCF ₃	0
H	C ₆ H ₅	F	6-F	4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	C ₆ H ₅	F	6-F	3,4-Cl ₂	0
H	C ₆ H ₅	F	6-F	2-F-4-Cl	0

【0073】

* * 【表37】

R ¹	R ²	X ¹	X ² ₁	Y _n	Z
H	C ₆ H ₅	F	6-F	2-F-4-O(C ₆ H ₅ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	C ₆ H ₅	F	6-F	4-Cl	0
H	C ₆ H ₅	F	6-F	4-CF ₃	0
H	CH(CH ₃) ₂	F	6-F	4-OCF ₃	0

57

H	CH(CH ₃) ₂	F	6-F	4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	CH(CH ₃) ₂	F	6-F	3,4-Cl ₂	0
H	CH(CH ₃) ₂	F	6-F	2-F-4-Cl	0
H	CH(CH ₃) ₂	F	6-F	2-F-4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	CH(CH ₃) ₂	F	6-F	4-Cl	0
H	CH(CH ₃) ₂	F	6-F	4-CF ₃	0
H	C(CH ₃) ₃	F	6-F	4-OCF ₃	0
H	C(CH ₃) ₃	F	6-F	4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	C(CH ₃) ₃	F	6-F	3,4-Cl ₂	0
H	C(CH ₃) ₃	F	6-F	2-F-4-Cl	0
H	C(CH ₃) ₃	F	6-F	2-F-4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	C(CH ₃) ₃	F	6-F	4-Cl	0
H	C(CH ₃) ₃	F	6-F	4-CF ₃	0
H	CH ₂ CH=CH ₂	F	6-F	4-OCF ₃	0
H	CH ₂ CH=CH ₂	F	6-F	4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	CH ₂ CH=CH ₂	F	6-F	3,4-Cl ₂	0
H	CH ₂ CH=CH ₂	F	6-F	2-F-4-Cl	0
H	CH ₂ CH=CH ₂	F	6-F	2-F-4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	CH ₂ CH=CH ₂	F	6-F	4-Cl	0

58

【0074】

* * 【表38】

R ¹	R ²	X ¹	X ² ₁	Y _a	Z
H	CH ₂ CH=CH ₂	F	6-F	4-CF ₃	0
H	CH ₂ C≡CH	F	6-F	4-OCF ₃	0
H	CH ₂ C≡CH	F	6-F	4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	CH ₂ C≡CH	F	6-F	3,4-Cl ₂	0
H	CH ₂ C≡CH	F	6-F	2-F-4-Cl	0
H	CH ₂ C≡CH	F	6-F	2-F-4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	CH ₂ C≡CH	F	6-F	4-Cl	0
H	CH ₂ C≡CH	F	6-F	4-CF ₃	0
H	CHF ₂	F	6-F	4-OCF ₃	0
H	CHF ₂	F	6-F	4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	CHF ₂	F	6-F	3,4-Cl ₂	0
H	CHF ₂	F	6-F	2-F-4-Cl	0
H	CHF ₂	F	6-F	2-F-4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	CHF ₂	F	6-F	4-Cl	0
H	CHF ₂	F	6-F	4-CF ₃	0
H	CF ₃	F	6-F	4-OCF ₃	0
H	CF ₃	F	6-F	4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	CF ₃	F	6-F	3,4-Cl ₂	0
H	CF ₃	F	6-F	2-F-4-Cl	0
H	CF ₃	F	6-F	2-F-4-O(C ₆ H ₃ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	CF ₃	F	6-F	4-Cl	0
H	CF ₃	F	6-F	4-CF ₃	0
H	CH ₂ OCH ₃	F	6-F	4-OCF ₃	0

【0075】

* * 【表39】

59

R ¹	R ²	X ¹	X ² ₁	Y _m	Z
H	CH ₂ OCH ₃	F	6-F	4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	CH ₂ OCH ₃	F	6-F	3,4-Cl ₂	0
H	CH ₂ OCH ₃	F	6-F	2-F-4-Cl	0
H	CH ₂ OCH ₃	F	6-F	2-F-4-O(C ₆ H ₅ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	CH ₂ OCH ₃	F	6-F	4-Cl	0
H	CH ₂ OCH ₃	F	6-F	4-CF ₃	0
H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	F	6-F	4-OCF ₃	0
H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	F	6-F	4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	F	6-F	3,4-Cl ₂	0
H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	F	6-F	2-F-4-Cl	0
H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	F	6-F	2-F-4-O(C ₆ H ₅ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	F	6-F	4-Cl	0
H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	F	6-F	4-CF ₃	0
H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	F	6-F	4-OCF ₃	0
H	Q51	F	6-F	4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	Q52	F	6-F	3,4-Cl ₂	0
H	Q53	F	6-F	2-F-4-Cl	0
H	Q54	F	6-F	2-F-4-O(C ₆ H ₅ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	CH ₂ Cl	F	6-F	4-Cl	0
H	CH=C(Cl)CF ₃	F	6-F	4-CF ₃	0
H	CH ₂ C≡CBr	F	6-F	4-OCF ₃	0
H	(Q54-1-Cl)	F	6-F	4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0
H	(CH ₂) ₅ CH ₃	F	6-F	3,4-Cl ₂	0

60

【0076】

* * 【表40】

R ¹	R ²	X ¹	X ² ₁	Y _m	Z
H	(C ₆ H ₄ -4-Cl)	F	6-F	2-F-4-Cl	0
H	(C ₆ H ₄ -4-CF ₃)	F	6-F	2-F-4-O(C ₆ H ₅ -2-Cl-4-CF ₃)	0
H	(C ₆ H ₄ -4-OCF ₃)	F	6-F	4-Cl	0
H	(C ₆ H ₅ -3,4-Cl ₂)	F	6-F	4-CF ₃	0
H	(C ₆ H ₅ -2-F-4-Cl)	F	6-F	4-OCF ₃	0
H	(C ₆ H ₄ -4-SCF ₃)	F	6-F	4-O(Q38-3-Cl-5-CF ₃)	0

【0077】本発明において有害生物防除剤とは、特に害虫防除剤を意味する。本発明化合物は極めて低い薬剤濃度で各種の有害な害虫に対して効力を示す。その害虫としては、例えば、ツマグロヨコバイ、トビイロウンカ、モモアカアブラムシ、ニジェウヤホシテントウ、ハスモンヨトウ、コブノメイガ、コナガ等の農業害虫、ナミハダニ、ミカンハダニ、カンザワハダニ等のハダニ類、アカイエカ、イエバエ、チャバネゴキブリ、アリ、ノミ、シラミ等の衛生害虫、コクゾウムシ、コクヌストモドキ、スジマグラメイガ等の貯穀害虫、シロアリのような家屋害虫、ダニ、ノミ、シラミ等の家畜害虫、コナダニ、ヒョウヒダニ、ツメダニ等の屋内塵性ダニ、ナメクジ、カタツムリ等の軟体動物等が挙げられる。すなわち50

※ち、本発明化合物は直翅目、半翅目、鱗翅目、鞘翅目、膜翅目、双翅目、シロアリ目およびダニ・シラミ類の害虫を低濃度で有効に防除できる。一方、本発明化合物はホ乱類、魚類、甲殻類および益虫に対してはほとんど悪影響がない極めて有用な化合物であることを見出し、本発明を完成した。

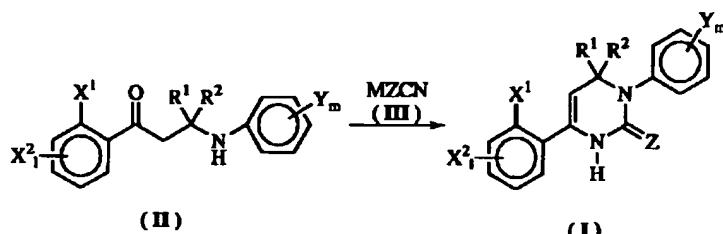
【0078】次に、本発明化合物の製造法について説明する。本発明化合物は新規なテトラヒドロピリミジノン誘導体であり、代表的な製造法を以下に具体的に説明する。

【0079】各方法（A法～B法）において、R¹、R²、X¹、X²、Y、Z、1及びmは前記と同じ意味を示し、Mはナトリウム、カリウム等のアルカリ金属を示す。

61

【0080】

A法



(II)

(I)

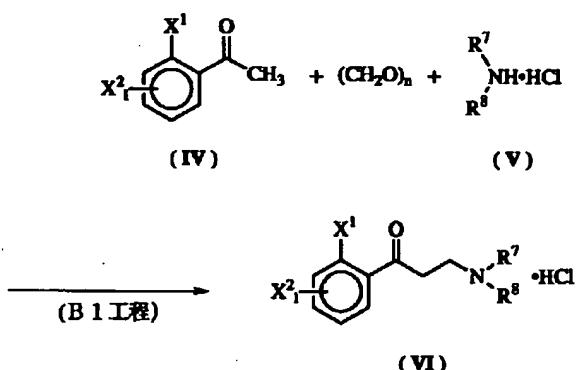
【0081】化合物(II)と化合物(III)とを不活性な溶媒中で反応させることにより本発明化合物(I)が得られる。化合物(III)はMとしては、ナトリウム、カリウム等のアルカリ金属であるシアノ酸またはチオシアノ酸のアルカリ金属塩である。溶媒としては、酢酸、ギ酸等の有機酸を用いるのが好ましい。また化合物(I)※

10※I)を塩化水素や臭化水素の塩として用いると反応が進行し易い。反応温度は0℃から反応混合物の還流温度までの任意の温度を設定できるが、室温から80℃までで行うのが好ましい。

【0082】

【化12】

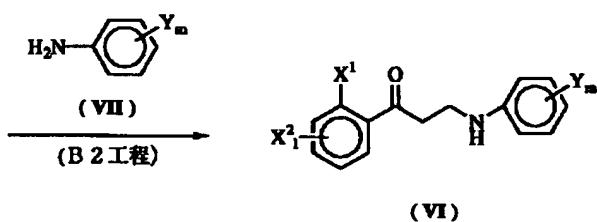
B法



(IV)

(V)

(VI)



(VII)

(B 2工程)

(VIII)

【0083】本法はR¹=R²=水素原子である場合の出発原料(II)の合成法である。化合物(IV)と化合物(V)をホルマリンまたはパラホルムアルデヒドと反応させることにより出発原料(II)のR¹=R²=水素原子である化合物(VIII)を得ることができる。B1工程は酸触媒の存在下、不活性な溶媒中で行うのが好ましい。酸触媒としては塩酸、硫酸またはパラトルエンスルホン酸等を化合物(IV)に対して0.1-10%程度用いるのが好ましい。溶媒としてはメタノール、エタノール等のアルコール類、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン等のエーテル類及び水等が挙げられる。これらの不活性溶媒は単独で使用してもよく、また、混合して使用することもできる。一般★50

★的にはメタノール、エタノール等のアルコール類と水の混合物を用いるのが好ましい。反応温度は0℃から反応混合物の還流温度までの任意の温度を設定することができるが、室温から還流温度まで行なうのが好ましい。

【0084】B2工程において用いられる溶媒としては、B1工程と同様のものが挙げられ、一般的にはメタノール、エタノール等のアルコール類と水の混合溶媒を用いるのが好ましい。反応温度は0℃から反応混合物の還流温度までの任意の温度を設定できるが、室温から還流温度まで行なうのが好ましい。化合物(VIII)はメタノール、エタノール等のアルコール中で濃塩酸または臭化水素水を加えることにより容易に塩酸塩または臭化水素塩とすることができます。

【0085】各方法において、各反応物質のモル比には

63

特に制限はないが、等モル又はそれに近い比率で反応を行なうのが有利である。

【0086】本発明化合物を精製する必要が生じた場合は、再結晶、カラムクロマトグラフィー、薄層クロマトグラフィー等の任意の精製方法によって分離、精製することができる。

【0087】本発明化合物を有害生物防除剤として施用するにあたっては、一般には適当な担体、例えばクレ一、タルク、ペントナイト、珪藻土、ホワイトカーボン等の固体担体あるいは水、アルコール類（イソプロパノール、ブタノール、ベンジルアルコール、フルフリルアルコール等）、芳香族炭化水素類（トルエン、キシレン等）、エーテル類（アニソール等）、ケトン類（シクロヘキサン、イソホロレン等）、エステル類（酢酸ブチル等）、酸アミド類（N-メチルピロリドン等）又はハログン化炭化水素類（クロルベンゼン等）などの液体担体と混用して適用することができ、所望により界面活性剤、乳化剤、分散剤、浸透剤、展着剤、増粘剤、凍結防止剤、固結防止剤、安定剤などを添加し、液剤、乳剤、水和剤、ドライフロアブル剤、フロアブル剤、粉剤、粒剤等任意の剤型にて実用に供することができる。

【0088】また、本発明化合物は必要に応じて製剤時又は散布時に他種の除草剤、各種殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、植物生長調節剤、共力剤、肥料、土壤改良剤などと混合施用しても良い。

【0089】特に他の農薬あるいは植物ホルモンと混合施用することにより、施用薬量の減少による低コスト化、混合薬剤の相乗作用による殺虫スペクトラムの拡大や、より高い有害生物防除効果が期待できる。この際、同時に複数の公知農薬との組み合わせも可能である。本発明化合物と混合使用する農薬の種類としては、例えば、ファーム・ケミカルズ・ハンドブック（Farm Chemicals Handbook）1994年版に記載されている化合物などがある。

【0090】本発明化合物の施用薬量は適用場面、施用時期、施用方法、栽培作物等により差異はあるが一般には有効成分量としてヘクタール（ha）当たり0.005～50kg程度が適当である。

【0091】次に具体的に本発明化合物を用いる場合の製剤の配合例を示す。但し本発明の配合例は、これらのみに限定されるものではない。なお、以下の配合例において「部」は重量部を意味する。

【0092】〔水和剤〕

本発明化合物····· 5~80部

固体担体····· 10~85部

界面活性剤····· 1~10部

その他····· 1~5 部

その他として、例えば固結防止剤などがあげられる。

【0093】〔乳 剂〕

本発明化合物····· 1~30部

64

液体担体····· 30~95部
界面活性剤····· 5~15部

【0094】〔フロアブル剤〕

本発明化合物····· 5~70部

液体担体····· 15~65部

界面活性剤····· 5~12部

その他····· 5~30部

その他として、例えば凍結防止剤、増粘剤等があげられる。

10 【0095】〔粒状水和剤（ドライフロアブル剤）〕

本発明化合物····· 20~90部

固体担体····· 10~60部

界面活性剤····· 1~20部

【0096】〔粒 剂〕

本発明化合物····· 0.1~10部

固体担体····· 90~99.9 部

その他····· 1~5 部

【0097】〔粉 剂〕

本発明化合物····· 0.01~30部

固体担体····· 67~99.5 部

その他····· 0~3 部

【0098】

【実施例】

実施例（合成例、製剤例、試験例）

以下、本発明について実施例（合成例、製剤例、試験例）を挙げて具体的に詳述する。

【0099】〔合成例〕本発明に包含される化合物は、以下に示した合成例に基づき製造した又は製造することができるが、本発明はこれらの化合物にのみ限定されるものではない。

【0100】合成例1

1-(4-クロロフェニル)-4-(2,6-ジフルオロフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリミジン-2-オン（本発明化合物No. 3）

3-(4-クロロアニリノ)-2',6'-ジフルオロプロピオフェノン塩酸塩1.52gを冰酢酸24mlに溶解し、攪拌しつつ60℃に加温する。60℃にてシアノ酸カリウム0.95gを一度に加えると発熱的に反応が進行する。60℃にて更に4時間攪拌を続けた後、室温まで放冷し、反応混合物を氷水100mlに注ぎ、析出した結晶を汎別する。汎取した結晶は酢酸エチル150mlに溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液100ml、水50ml及び3N塩酸100mlの順で洗浄し、次いで飽和食塩水で脱水、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下に溶媒を留去し、得られた結晶をジイソプロピルエーテル-ジエチルエーテルの混合溶媒にて洗浄することにより表題化合物の白色結晶1.28gを得た。（収率87.1%）

融点：214.5~216.0℃

50 【0101】合成例2

67

カーブレックス#80(固結防止剤) 2部
 (ホワイトカーボン: 塩野義製薬(株)商品名)
 以上を均一に混合粉碎して水和剤とする。
【0110】〔製剤例2〕乳 剤
 本発明化合物 3部
 キシレン 76部
 イソホロン 15部
 ソルボール3005X 6部
 (非イオン性界面活性剤とアニオン性界面活性剤との混合物: 東邦化学工業(株)商品名)
 以上を均一に混合して乳剤とする。

【0111】〔製剤例3〕フロアブル剤
 本発明化合物 35部
 アグリゾールS-711 8部
 (非イオン性界面活性剤: 花王(株)商品名)
 ルノックス1000C 0.5部
 (アニオン性界面活性剤: 東邦化学工業(株)商品名)
 1%ロドボール水 20部
 (増粘剤: ローン・ブラン社商品名)
 エチレングリコール(凍結防止剤) 8部
 水 28.5部
 以上を均一に混合して、フロアブル剤とする。

【0112】〔製剤例4〕粒状水和剤(ドライフロアブル剤)
 本発明化合物 75部
 イソバンNo.1 10部
 (アニオン性界面活性剤: クラレイソフレンケミカル(株)商品名)
 バニレックスN 5部
 (アニオン性界面活性剤: 山陽国策バルブ(株)商品名)
 カーブレックス#80 10部
 (ホワイトカーボン: 塩野義製薬(株)商品名)
 以上を均一に混合微粉碎してドライフロアブル剤とする。

【0113】〔製剤例5〕粒 剤
 本発明化合物 0.1部
 ベントナイト 55.0部
 タルク 44.9部
 以上を均一に混合粉碎した後、少量の水を加えて攪拌混 40 合捏和し、押出式造粒機で造粒し、乾燥して粒剤にする。

【0114】〔製剤例6〕粉 剂
 本発明化合物 3.0部
 カーブレックス#80 0.5部
 (ホワイトカーボン: 塩野義製薬(株)商品名)
 クレー 95部
 リン酸ジイソプロピル 1.5部
 以上を均一に混合粉碎して粉剤とする。

【0115】使用に際しては上記水和剤、乳剤、フロア 50 本発明化合物: No. 1, 2, 4, 6, 7.

68

ブル剤、粒状水和剤は水で50~20000倍に希釈して有効成分が1ヘクタール(ha)当たり0.005~50kgになるように散布する。

【0116】〔試験例〕次に、本発明化合物の有害生物防除剤としての有用性について、以下の試験例において具体的に説明する。

【0117】試験例1 トビイロウンカに対する殺虫試験

明細書に記載された本発明化合物の5%乳剤(化合物によっては25%水和剤を供試)を展着剤の入った水で希釈して、1000ppm濃度の薬液に調製した。この薬液を1/20,000アールのポットに植えたイネの茎葉に十分量散布した。風乾後、円筒をたて、トビイロウンカの2令幼虫をポット当たり、10頭放虫し、蓋をし、恒温室に保管した。調査は6日経過後に行い死虫率を下記の計算式から求めた。尚、試験は2区制で行なった。

【0118】

$$\text{死虫率} (\%) = (\text{死虫数} / \text{放虫数}) \times 100$$

その結果、以下の化合物が100%の死虫率を示した。

【0119】本発明化合物: No. 1, 2, 3, 4。

【0120】試験例2 ハスモンヨトウに対する殺虫試験

明細書に記載された本発明化合物の5%乳剤(化合物によっては25%水和剤を供試)を展着剤の入った水で希釈して、1000ppm濃度の薬液に調製し、この薬液中にカンランの葉を約10秒間浸漬し、風乾後シャーレに入れ、この中にハスモンヨトウ2令幼虫をシャーレ当たり10頭を放虫し、孔のあいた蓋をして25°C恒温室に収容し、6日間経過後の死虫率を下記の計算式から求めた。尚、試験は2区制で行なった。

【0121】

$$\text{死虫率} (\%) = (\text{死虫数} / \text{放虫数}) \times 100$$

【0122】その結果、以下の化合物が100%の死虫率を示した。

本発明化合物: No. 2, 3, 4, 7。

【0123】試験例3 ニジュウヤホシテントウに対する殺虫試験

明細書に記載された本発明化合物の5%乳剤(化合物によっては25%水和剤を供試)を展着剤の入った水で希釈して、1000ppm濃度の薬液に調製し、この薬液中にトマトの葉を約10秒間浸漬し、風乾後シャーレに入れ、この中にニジュウヤホシテントウ2令幼虫をシャーレ当たり10頭を放虫し、蓋をして25°C恒温室に収容し、6日間経過後の死虫率を下記の計算式から求めた。尚、試験は2区制で行なった。

【0124】

$$\text{死虫率} (\%) = (\text{死虫数} / \text{放虫数}) \times 100$$

【0125】その結果、以下の化合物が100%の死虫率を示した。

本発明化合物: No. 1, 2, 4, 6, 7.

【0126】

【発明の効果】本発明化合物は多くの農業害虫、ハダニ類に対して優れた殺虫・殺ダニ活性を有し、かつホ乳

類、魚類及び益虫に対してはほとんど悪影響を及ぼさない。従って、本発明化合物は、有用な有害生物防除剤を提供することができる。

フロントページの続き

(51) Int. Cl. ⁶	識別記号	序内整理番号	F I	技術表示箇所
A 01 N	43/58			
	43/60			
	43/647			
	43/653			
	43/76			
	43/78			
	43/80	101		
		102		
	43/832			
	43/836			
C 07 D	401/12	239		
	403/12	207		
		231		
		233		
		237		
		239		
	405/12	239		
	409/12	239		
	413/12	239		
	417/12	239		

(72) 発明者 工藤 正毅
東京都千代田区神田錦町3-7-1 日産
化学工業株式会社内

(72) 発明者 井上 洋一
埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡1470 日産
化学工業株式会社生物科学研究所内
(72) 発明者 三宅 敏郎
埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡1470 日産
化学工業株式会社生物科学研究所内

PAT-NO: JP408027120A
DOCUMENT-IDENTIFIER: JP 08027120 A
TITLE: TETRAHYDROPYRIMIDINONE DERIVATIVE

PUBN-DATE: January 30, 1996

INVENTOR-INFORMATION:

NAME	COUNTRY
MITA, TAKESHI	
NUMATA, AKIRA	
ISHII, SHIGERU	
KUDO, MASAKI	
INOUE, YOICHI	
MIYAKE, TOSHIRO	

ASSIGNEE-INFORMATION:

NAME	COUNTRY
NISSAN CHEM IND LTD	N/A

APPL-NO: JP06157053

APPL-DATE: July 8, 1994

INT-CL C07D239/22 , A01N043/54 , A01N043/56 , A01N043/58 ,
(IPC): A01N043/60 , A01N043/647 , A01N043/653 , A01N043/76 ,
A01N043/78 , A01N043/80 , A01N043/80 , A01N043/832 ,
A01N043/836 , C07D401/12 , C07D403/12 , C07D403/12 ,
C07D403/12 , C07D403/12 , C07D403/12 , C07D405/12 ,
C07D409/12 , C07D413/12 , C07D417/12

ABSTRACT:

PURPOSE: To obtain a new compound having excellent insecticidal and acaricidal activities against various kinds of agricultural harmful insects and spider mites, almost free from harmful effects against mammals, fishes and beneficial insects and useful as pest controlling agent.

CONSTITUTION: This is a compound of formula I (R1 and R2 are each H, a 1-6C alkyl, a 3-6C cycloalkyl, a 2-6C alkenyl, a 2-6C alkoxyalkyl, a (substituted) phenyl, etc. ; X1 and X2 are each a halogen, a 1-4C alkyl, a 1-4C alkoxy, a 1-4C alkylthio, NH₂, CN, NO₂, etc.; l=0-4; Y is a halogen, a 1-6C alkyl, a 2-6C alkenyl, a 2-6C alkynyl, a 3-6C cycloalkyl, a 1-6C alkoxy, NO₂, CN, OH, carboxyl, etc.; m=1-5; Z is O, S or NH), e.g. 1-(4-chlorophenyl)-4-(2,6-difluorophenyl)-1,2,3,6-tetrahydropyrimidin-2-one. The compound is obtained by reacting a compound of formula II with a compound of formula III (M is an alkali metal) in an inert solvent.

COPYRIGHT: (C)1996,JPO